

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 201991839 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2020.02.17(51) Int. Cl. C07D 405/14 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01)(22) Дата подачи заявки
2018.01.29

(54) НОВЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ ТРИАЗОЛТИОНА

(31) 17155156.7

(32) 2017.02.08

(33) EP

(86) PCT/EP2018/052054

(87) WO 2018/145933 2018.08.16

(71) Заявитель:

БАЙЕР АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ;
БАЙЕР КРОПСАЙЕНС
АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ (DE)

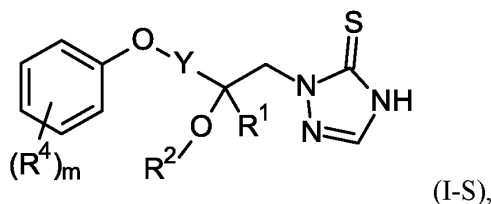
(72) Изобретатель:

Гёртц Андреас, Майсснер Рут,
Миллер Рикарда (DE), Нод Зебастиэ,
Берни Давид, Женикс Пьер, Брюне
Стефан, Кеннель Филипп, Кокеро
Пьер-Иф (FR)

(74) Представитель:

Беляева Е.Н. (BY)

(57) Настоящее изобретение касается новых производных триазола формулы (I-S)



способов получения указанных соединений, композиций, содержащих указанные соединения, а также их применения в качестве биологически активных соединений, в частности, для борьбы с вредными микроорганизмами при защите растений и при защите материалов, а также в качестве регуляторов роста.

A1

201991839

201991839

A1

Новые производные триазолтиона

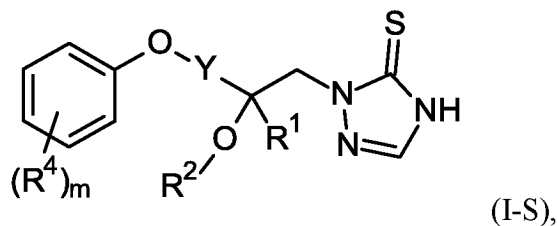
Настоящее изобретение относится к новым производным триазолтиона, к способам получения этих соединений, к композициям, содержащим эти соединения, и к их применению в качестве биологически активных соединений, в частности, для борьбы с вредными микроорганизмами при защите растений и при защите материалов, а также в качестве регуляторов роста.

Известно, что определенные производные фенокси-фенил-замещенного триазола проявляют фунгицидную активность (например, EP-A 0 275 955; J. Agric. Food Chem. 2009, 57, 4854-4860; CN-A 101225074, DE-A 40 03 180; EP-A 0 113 640; EP-A 0 470 466; US 4,949,720; EP-A 0 126 430, DE-A 38 01 233; WO-A 2013/007767; WO-A 2013/010862; WO-A 2013/010885; WO-A 2013/010894; WO-A 2013/024075; WO-A 2013/024076; WO-A 2013/024077; WO-A 2013/024080; WO-A 2013/024081; WO-A 2013/024082; WO-A 2013/024083 и WO-A 2014/082872). Также известно, что определенные производные фенокси-фенил-замещенного триазолтиона (например, WO-A 2010/146114), определенные производные гетарилокси-фенил-замещенного триазолтиона (например, WO-A 2010/146115) и определенные производные фенокси-гетарил- и гетероцикл-О-гетарил-замещенного триазолтиона (например, WO-A 2010/146116) могут быть использованы для защиты посевов в качестве фунгицидов.

Так как экологические и экономические требования к современным активным ингредиентам, например, фунгицидам, постоянно растут, например, в отношении эффективности, спектра их активности, токсичности, селективности, доз внесения, образования отходов, а также выгодных способов производства, кроме того, могут возникать проблемы, связанные, например, с устойчивостью, существует постоянная потребность в разработке новых фунгицидных композиций, которые обладали бы преимуществами по сравнению с уже известными композициями, по меньшей мере, по определенным параметрам.

Для удовлетворения такой потребности разработаны новые производные фенокси-гетарил-замещенного триазола, и являются предметом WO-A 2017/029179. Было обнаружено, что в качестве фунгицидов могут быть использованы также соответствующие производные тиона.

Соответственно, настоящее изобретение предоставляет новые производные триазола формулы (I-S)



в которой

R^1 представляет собой водород, C_1 - C_6 -алкил, C_2 - C_6 -алкенил, C_2 - C_6 -алкинил, C_3 - C_8 -циклоалкил, C_3 - C_8 -циклоалкил- C_1 - C_4 -алкил, фенил, фенил- C_1 - C_4 -алкил, фенил- C_2 - C_4 -алкенил или фенил- C_2 - C_4 -алкинил;

R^2 представляет собой водород, C_1 - C_6 -алкил, C_2 - C_6 -алкенил, C_2 - C_6 -алкинил, C_3 - C_8 -циклоалкил, C_3 - C_8 -циклоалкил- C_1 - C_4 -алкил, фенил, фенил- C_1 - C_4 -алкил, фенил- C_2 - C_4 -алкенил или фенил- C_2 - C_4 -алкинил;

причем алифатические фрагменты, за исключением циклоалкильных фрагментов, R^1 и/или R^2 могут нести 1, 2, 3 или до максимально возможного количества одинаковых или различных групп R^a , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, фенила, C_1 - C_4 -алкокси и C_1 - C_4 -галогеналкокси, причем фенил может быть замещен 1, 2, 3, 4 или 5 заместителями, которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила, C_1 - C_4 -галогеналкокси,

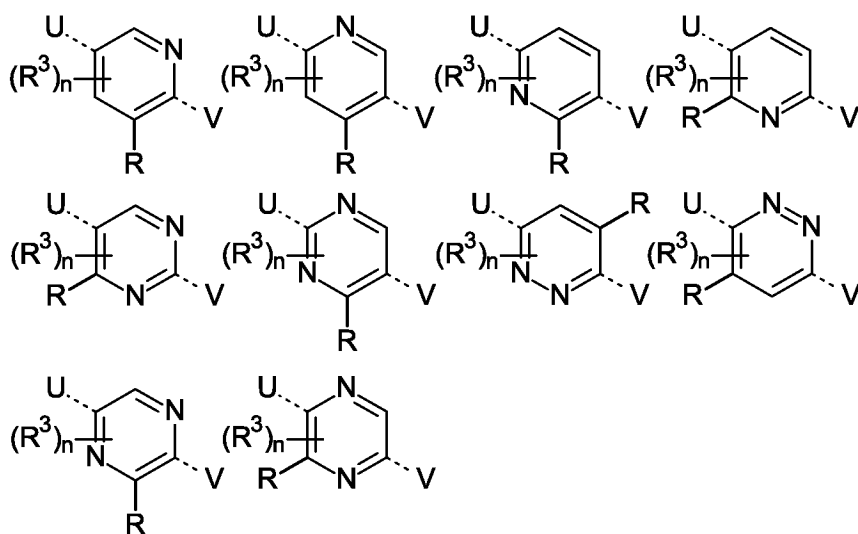
и причем циклоалкильные и/или фенильные фрагменты R^1 и/или R^2 могут нести 1, 2, 3, 4, 5 или до максимального количества одинаковых или различных групп R^b , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила и C_1 - C_4 -галогеналкокси;

каждый R^4 представляет собой независимо друг от друга галоген, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкил, C_1 - C_4 -галогеналкил, C_3 - C_6 -циклоалкил, C_3 - C_6 -галогенциклоалкил, C_1 - C_4 -алкил- C_3 - C_6 -циклоалкил, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкокси, гидроксизамещенный C_1 - C_4 -алкил, C_2 - C_6 -алкенил, C_2 - C_6 -галогеналкенил, C_2 - C_6 -алкинил, C_2 - C_6 -галогеналкинил,

C₁-C₄-алкилсульфанил, C₁-C₄-галогеналкилсульфанил, формил, C₁-C₄-алкилкарбонил, пентафтор-λ⁶-сульфанил или –C(R^{4a})=N-OR^{4b}, причем R^{4a} и R^{4b} представляют собой независимо друг от друга водород, C₁-C₆-алкил или фенил;

m представляет собой целое число и означает 0, 1, 2, 3, 4 или 5;

Y представляет собой 6-членный ароматический гетероцикл, содержащий 1 или 2 атома азота в качестве гетероатома(ов), выбранный из



причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную “U”, и Y связан с CR¹(OR²) фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную “V”, и

причем

R представляет собой водород, C₁-C₂-галогеналкил, C₁-C₂-галогеналкокси, C₁-C₂-алкилкарбонил или галоген;

каждый R³ представляет собой независимо друг от друга галоген, CN, нитро, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-галогеналкил, C₁-C₄-алкокси или C₁-C₄-галогеналкокси;

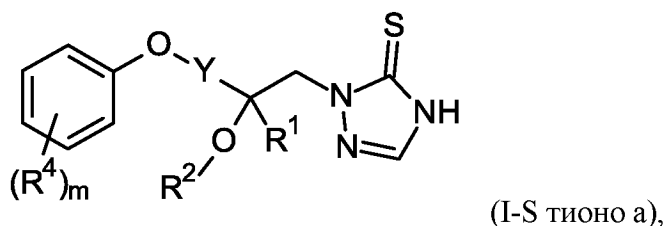
n представляет собой целое число и означает 0 или 1;

а также его соли или N-оксиды.

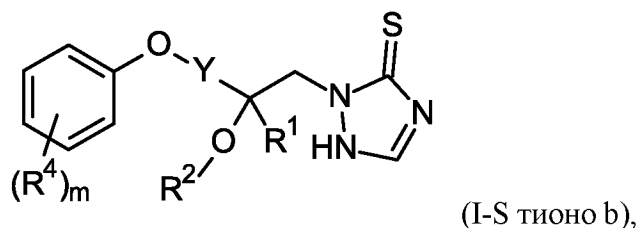
Соли или N-оксиды производных триазола формулы (I-S) также обладают фунгицидными свойствами.

Общее определение производных триазола по изобретению предоставляется формулой (I-S). Предпочтительные определения для радикалов формул, приведенных выше и ниже, указаны ниже. Эти определения применяются для конечных продуктов формулы (I-S), а также, аналогичным образом, для всех промежуточных соединений.

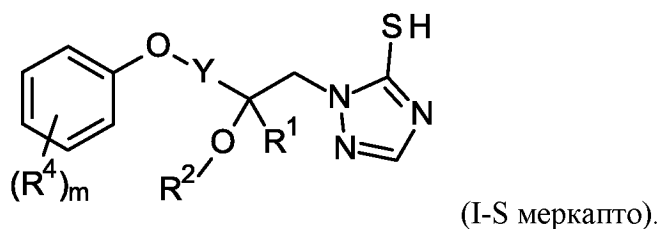
Производные триазола формулы (I-S) могут присутствовать в любых их таутомерных формах, включая тионо-формы в соответствии с формулой



с формулой



и меркапто-форму в соответствии с формулой



В настоящем документе, по соображениям простоты, в приведенной формуле используется лишь одна форма тионо. Однако производные триазола формулы (I-S) включают все таутомерные формы, т.е. производные триазола формулы (I-S) в приведенной форме тионо, а также в таутомерных формах тионо и меркапто. То же самое относится и к любому промежуточному соединению, содержащему триазолтионое кольцо.

R^1 предпочтительно представляет собой водород, C_1 - C_4 -алкил, C_2 - C_6 -алкенил, C_2 - C_6 -алкинил, циклопропил, фенил, бензил, фенилэтинил или фенилэтинил,

причем алифатические фрагменты, за исключением циклоалкильных фрагментов, R^1 могут нести 1, 2, 3 или до максимально возможного количества одинаковых или различных групп R^a , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, фенила, C_1 - C_4 -алкокси и C_1 - C_4 -галогеналкокси, причем фенил может быть замещен 1, 2, 3, 4 или 5 заместителями, выбранными независимо друг от друга из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила, C_1 - C_4 -галогеналкокси,

и причем циклоалкильные и/или фенильные фрагменты R^1 могут нести 1, 2, 3, 4, 5 или до максимального количества одинаковых или различных групп R^b , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила и C_1 - C_4 -галогеналкокси.

R^1 более предпочтительно представляет собой водород, метил, этил, пропил, изопропил, бутил, циклопропил, бензил, аллил, $CH_2C\equiv C-CH_3$ или $CH_2C\equiv CH$,

причем алифатические группы R^1 могут нести 1, 2, 3 или до максимально возможного количества одинаковых или различных групп R^a , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, фенила, C_1 - C_4 -алкокси и C_1 - C_4 -галогеналкокси, причем фенил может быть замещен 1, 2, 3, 4 или 5 заместителями, выбранными независимо друг от друга из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила, C_1 - C_4 -галогеналкокси.

R^1 более предпочтительно представляет собой водород, метил, этил, пропил, изопропил, бутил, циклопропил, CF_3 , бензил, аллил, $CH_2C\equiv C-CH_3$ или $CH_2C\equiv CH$.

R^1 более предпочтительно представляет собой водород, метил, этил или циклопропил.

R^1 более предпочтительно представляет собой водород или метил.

R^1 также более предпочтительно представляет собой метил или циклопропил.

R^1 наиболее предпочтительно представляет собой метил.

R^2 предпочтительно представляет собой водород, C_1 - C_4 -алкил, аллил, пропаргил или бензил,

причем алифатические фрагменты R^2 могут нести 1, 2, 3 или до максимально возможного количества одинаковых или различных групп R^a , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, фенил, C_1 - C_4 -алкокси и C_1 - C_4 -галогеналкокси, причем фенил может быть замещен 1, 2, 3, 4 или 5 заместителями, выбранными независимо друг от друга из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкил, C_1 - C_4 -галогеналкокси,

и причем фенильные фрагменты R^2 могут нести 1, 2, 3, 4, 5 или до максимального количества одинаковых или различных групп R^b , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила и C_1 - C_4 -галогеналкокси.

R^2 более предпочтительно представляет собой водород, метил, этил, изопропил или аллил,

причем алифатические группы R^2 могут нести 1, 2, 3 или до максимально возможного количества одинаковых или различных групп R^a , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, фенила, C_1 - C_4 -алкокси и C_1 - C_4 -галогеналкокси, причем фенил может быть замещен 1, 2, 3, 4 или 5 заместителями, выбранными независимо друг от друга из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила, C_1 - C_4 -галогеналкокси.

R^2 более предпочтительно представляет собой водород или незамещенный метил, этил, изопропил или аллил.

R^2 более предпочтительно представляет собой водород или метил.

R^2 наиболее предпочтительно представляет собой водород.

Каждый R^4 предпочтительно представляет собой независимо друг от друга галоген, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкил, C_1 - C_4 -галогеналкил, циклопропил, галогенциклопропил, метилциклопропил, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкокси, C_2 - C_6 -алкенил, C_2 - C_6 -галогеналкенил, C_2 - C_6 -алкинил,

C_2 - C_6 -галогеналкинил, C_1 - C_4 -алкилсульфанил, C_1 - C_4 -галогеналкилсульфанил, формил, пентафтор- λ^6 -сульфанил или $-C(R^{4a})=N-OR^{4b}$, причем R^{4a} и R^{4b} представляют собой независимо друг от друга водород, C_1 - C_6 -алкил или фенил;

Каждый R^4 более предпочтительно представляет собой независимо друг от друга галоген, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкил, C_1 - C_4 -галогеналкил, циклопропил, 1-фторциклопропил, 1-хлорциклопропил, 1-метилциклопропил, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкокси, винил, аллил, пропаргил, C_1 - C_4 -алкилсульфанил, C_1 - C_4 -галогеналкилсульфанил, формил, пентафтор- λ^6 -сульфанил или $-C(R^{4a})=N-OR^{4b}$,

причем R^{4a} и R^{4b} представляют собой независимо друг от друга водород или C_1 - C_4 -алкил, предпочтительно водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил или трет-бутил, более предпочтительно водород или метил.

Каждый R^4 более предпочтительно представляет собой независимо друг от друга Br, Cl, F, CN, нитро, метил, этил, н-пропил, изопропил, CHF_2 , CF_3 , циклопропил, 1-фторциклопропил, 1-хлорциклопропил, 1-метилциклопропил, метокси, OCF_3 , винил, аллил, пропаргил, SCH_3 , SCF_3 , формил, пентафтор- λ^6 -сульфанил или $-C(R^{4a})=N-OR^{4b}$,

причем R^{4a} и R^{4b} представляют собой независимо друг от друга водород или C_1 - C_4 -алкил, предпочтительно водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил или трет-бутил, более предпочтительно водород или метил.

Каждый R^4 более предпочтительно представляет собой независимо друг от друга Br, Cl, F, CN, нитро, метил, этил, н-пропил, изопропил, CHF_2 , CF_3 , метокси, OCF_3 , SCH_3 , SCF_3 , пентафтор- λ^6 -сульфанил или $-C(R^{4a})=N-OR^{4b}$,

причем R^{4a} представляет собой водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил или трет-бутил, предпочтительно водород или метил, R^{4b} представляет собой водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил или трет-бутил, предпочтительно водород или метил.

Каждый R^4 более предпочтительно представляет собой независимо друг от друга CF_3 , CHF_2 , OCF_3 , SCH_3 , SCF_3 , Br, Cl или пентафтор- λ^6 -сульфанил.

Каждый R^4 более предпочтительно представляет собой независимо друг от друга CF_3 , CHF_2 , OCF_3 , Br, Cl или пентафтор- λ^6 -сульфанил.

Каждый R^4 более предпочтительно представляет собой независимо друг от друга CF_3 , CHF_2 , OCF_3 , Br, Cl или пентафтор- λ^6 -сульфанил в 4-положении фенильного фрагмента формулы (I-S).

Каждый R^4 наиболее предпочтительно представляет собой независимо друг от друга CF_3 , Br или Cl во 2- и/или 4-положении, предпочтительно в 4-положении, фенильного фрагмента формулы (I-S).

m предпочтительно означает 0, 1, 2 или 3.

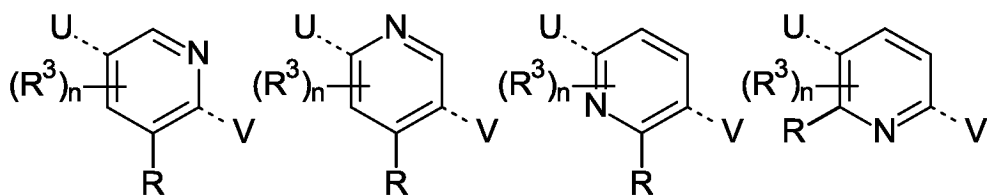
m более предпочтительно означает 0, 1 или 2.

m наиболее предпочтительно означает 0 или 1.

В одном предпочтительном варианте осуществления m представляет собой 0.

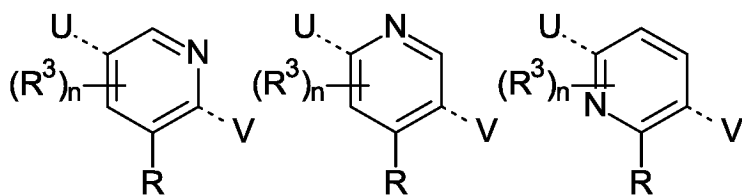
В другом предпочтительном варианте осуществления m представляет собой 1, и R^4 представляет собой CF_3 , CHF_2 , OCF_3 , Br, Cl или пентафтор- λ^6 -сульфанил, предпочтительно CF_3 , CHF_2 , OCF_3 , Br, Cl или пентафтор- λ^6 -сульфанил в 4-положении фенильного фрагмента формулы (I-S), более предпочтительно CF_3 , Br или Cl во 2- и/или 4-положении, предпочтительно в 4-положении, фенильного фрагмента формулы (I-S).

Y предпочтительно представляет собой



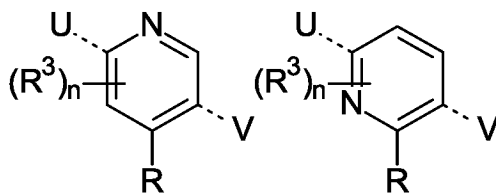
причем R, R^3 и n имеют значения, как указано выше для формулы (I-S).

Y более предпочтительно представляет собой



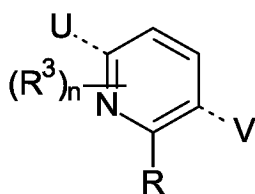
причем R, R^3 и n имеют значения, как указано выше для формулы (I-S).

Y еще более предпочтительно представляет собой



причем R, R^3 и n имеют значения, как указано выше для формулы (I-S).

Y наиболее предпочтительно представляет собой



причем R, R^3 и n имеют значения, как указано выше для формулы (I-S).

R предпочтительно представляет собой водород, C_1 - C_2 -галогеналкил или галоген;

R более предпочтительно представляет собой водород, C_1 -галогеналкил, F или Cl.

R более предпочтительно представляет собой C_1 -галогеналкил, F или Cl.

R еще более предпочтительно представляет собой CF_3 или Cl.

R наиболее предпочтительно представляет собой CF_3 .

n предпочтительно означает 0.

Однако определения и толкования для радикалов, приведенные выше в разделе с общими положениями или указанные в предпочтительных рядах значений, могут также, при необходимости, комбинироваться между собой, т.е. между

частными и предпочтительными рядами значений. Эти определения применяются для конечных продуктов, а также, соответственно, образом, для прекурсоров и промежуточных соединений. В дополнение, отдельные определения могут не применяться.

Предпочтение отдается тем соединениям формулы (I), в которых каждый из радикалов имеет вышеупомянутые предпочтительные определения.

Особое предпочтение отдается тем соединениям формулы (I), в которых каждый из радикалов имеет вышеупомянутые более и/или наиболее предпочтительные определения.

В предпочтительном варианте осуществления настоящего изобретения

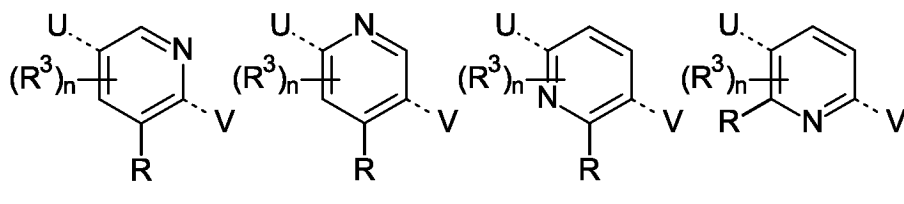
R^1 представляет собой водород или C_1 - C_4 -алкил, предпочтительно водород, метил или этил;

R^2 представляет собой водород;

R^4 представляет собой CF_3 , CHF_2 , OCF_3 , Br, Cl или пентафтор- λ^6 -сульфанил, предпочтительно CF_3 , CHF_2 , OCF_3 , Br, Cl или пентафтор- λ^6 -сульфанил в 4-положении фенильного фрагмента формулы (I-S), более предпочтительно CF_3 , Br или Cl во 2- и/или 4-положении, предпочтительно в 4-положении, фенильного фрагмента формулы (I-S);

m представляет собой 1;

Y представляет собой



причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную “U”, и Y связан с $CR^1(OR^2)$ фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную “V”, и

причем

R представляет собой C_1 -галогеналкил, F или Cl, предпочтительно CF_3 или Cl, более предпочтительно CF_3 ; и

n представляет собой 0.

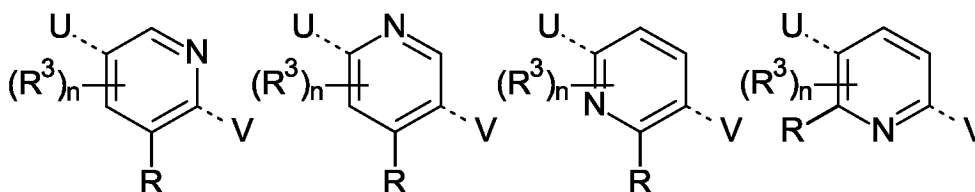
В дальнейших предпочтительных вариантах осуществления настоящего изобретения

R^1 представляет собой водород или C_1 - C_4 -алкил, предпочтительно водород, метил или этил;

R^2 представляет собой водород;

m представляет собой 0;

Y представляет собой



причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную “U”, и Y связан с $CR^1(OR^2)$ фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную “V”, и

причем

R представляет собой C_1 -галогеналкил, F или Cl, предпочтительно CF_3 или Cl, более предпочтительно CF_3 ; и

n представляет собой 0.

В более предпочтительных вариантах осуществления настоящего изобретения

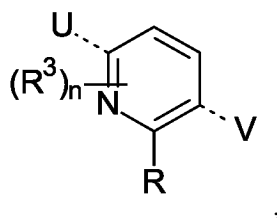
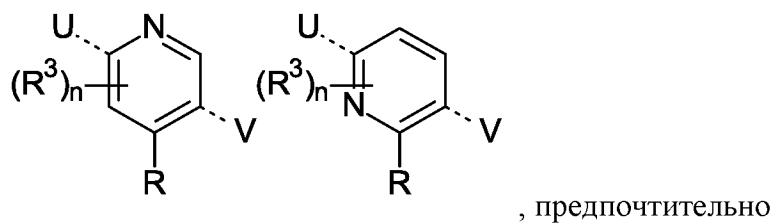
R^1 представляет собой водород или метил, предпочтительно метил;

R^2 представляет собой водород;

R^4 представляет собой CF_3 , CHF_2 , OCF_3 , Br, Cl или пентафтор- λ^6 -сульфанил в 4-положении фенильного фрагмента формулы (I-S), предпочтительно CF_3 , Br или Cl в 4-положении фенильного фрагмента формулы (I-S);

m представляет собой 1;

Y представляет собой



причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную " U ", и Y связан с $CR^1(OR^2)$ фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную " V ", и

причем

R представляет собой CF_3 или Cl , предпочтительно CF_3 ; и

n представляет собой 0.

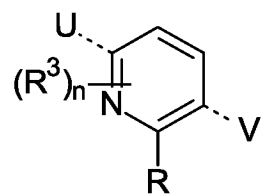
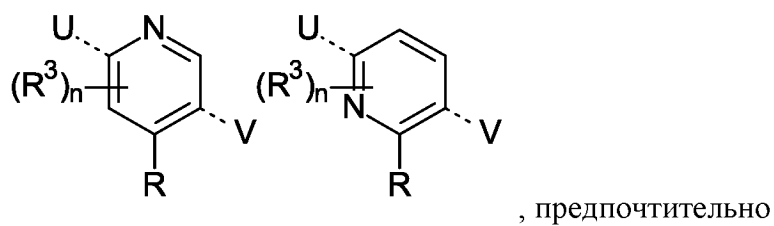
В дальнейших более предпочтительных вариантах осуществления настоящего изобретения

R^1 представляет собой водород или метил, предпочтительно метил;

R^2 представляет собой водород;

m представляет собой 0;

Y представляет собой



причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную “U”, и Y связан с $CR^1(OR^2)$ фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную “V”, и

причем

R представляет собой CF_3 или Cl, предпочтительно CF_3 ; и

n представляет собой 0.

В определениях символов в указанных выше формулах используются собирательные понятия, которые, в целом, относятся к следующим заместителям:

Определение C_1 - C_6 -алкила включает наиболее широкий ряд значений, определенных в настоящем документе для алкинильных радикалов. В частности, это определение включает в себя следующие значения: метил, этил, н-, изопропил, н-, изо-, втор-, трет-бутил, а также в каждом случае все изомерные пентилы и гексилы, такие метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,2-диметилпропил, 1,1-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 1,1-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1-этил-3-метилпропил, в частности, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилэтил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, н-пентил, 1-метилбутил, 1-этилпропил, гексил, 3-метилпентил. Предпочтительный ряд значений: C_1 - C_4 -алкил, такой как метил, этил, н-, изопропил, н-, изо-, втор-, трет-бутил. Определение C_1 - C_2 -алкила включает метил и этил.

Определение галогена включает фтор, хлор, бром и йод. Галоген-замещение, как правило, обозначается префиксом гало, галоген или галогено.

Галоген-замещенный алкил, например, именуемый галогеналкил, галогеноалкил или галоалкил, например, C_1 - C_4 -галогеналкил или C_1 - C_2 -галогеналкил, представляет собой, например, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_2 -алкил в соответствии с определением выше, замещенный одним или более галогеновыми заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными. Предпочтительно C_1 - C_4 -галогеналкил представляет собой хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил,

дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, 2-хлор-2-фторэтил, 2-хлор-2,2-дифторэтил, 2,2-дихлор-2-фторэтил, 2,2,2-трихлорэтил, 1,1-дифторэтил, пентафторэтил, 1-фтор-1-метилэтил, 2-фтор-1,1-диметилэтил, 2-фтор-1-фторметил-1-метилэтил, 2-фтор-1,1-ди(фторметил)-этил, 1-хлорбутил. Предпочтительно C_1 - C_2 -галогеналкил представляет собой хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, 2-хлор-2-фторэтил, 2-хлор-2,2-дифторэтил, 2,2-дихлор-2-фторэтил, 2,2,2-трихлорэтил, 1,1-дифторэтил, пентафторэтил.

Моно- или мультифторированный C_1 - C_4 -алкил представляет собой, например, C_1 - C_4 -алкил в соответствии с определением выше, замещенный одним или более заместителями фтора. Предпочтительно моно- или мультифторированный C_1 - C_4 -алкил представляет собой фторметил, дифторметил, трифторметил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, пентафторэтил, 1-фтор-1-метилэтил, 2-фтор-1,1-диметилэтил, 2-фтор-1-фторметил-1-метилэтил, 2-фтор-1,1-ди(фторметил)-этил, 1-метил-3-трифторметилбутил, 3-метил-1-трифторметилбутил.

Определение C_2 - C_6 -алкенила включает наиболее широкий ряд значений, определенных в настоящем документе для алкенильных радикалов. В частности, это определение включает значения: этенил, н-, изопропенил, н-, изо-, втор-, трет-бутенил, а также в каждом случае все изомерные пентенилы, гексенилы, 1-метил-1-пропенил, 1-этил-1-бутенил. Галоген-замещенный алкенил, например, именуемый C_2 - C_6 -галогеналкенилом, представляет собой, например, C_2 - C_6 -алкенил в соответствии с определением выше, замещенный одним или более галогеновыми заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными.

Определение C_2 - C_6 -алкинила включает наиболее широкий ряд значений, определенных в настоящем документе для алкинильных радикалов. В частности, это определение включает следующие значения: этинил, н-, изопропинил, н-, изо-, втор-, трет-бутинил, а также в каждом случае все изомерные пентинилы, гексинилы. Галоген-замещенный алкинил, например, именуемый C_2 - C_6 -галогеналкинилом, представляет собой, например, C_2 - C_6 -алкинил в соответствии с определением выше, замещенный одним или более галогеновыми заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными.

Определение C₃-C₈-циклоалкила включает моноциклические насыщенные гидрокарбильные группы с 3 - 8 членами углеродного кольца, такие как циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил и циклооктил.

Определение «галоген-замещенный циклоалкил», также именуемый «галогеноциклоалкил», «галогенциклоалкил» или «галогенциклоалкил», включает моноциклические насыщенные гидрокарбильные группы с 3 - 8 членами углеродного кольца, которые замещены одним или более галогеновыми заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными, такие как 1-фтор-циклопропил и 1-хлор-циклопропил.

Определение арила включает ароматические, моно-, би- или трициклические углеродные кольца, например, фенил, нафтил, антраценил (антрил), фенантраценил (фенантрил).

При необходимости, замещенные радикалы могут быть моно- или полизамещенными, где, в случае полизамещения, заместители могут быть одинаковыми или различными.

Если не указано иное, группа или заместитель, которые замещаются согласно данному изобретению предпочтительно могут быть замещены одной или более группами, выбранными из перечня, состоящего из галогена, SH, нитро, гидроксила, циано, amino, сульфанила, пентафтор- λ^6 -сульфанила, формила, формилокси, формиламино, карбамоила, N-гидроксикарбамоила, карбамата, (гидроксиимино)-C₁-C₆-алкила, C₁-C₈-алкила, C₁-C₈-галогеналкила, C₁-C₈-алкилокси, C₁-C₈-галогеналкилокси, C₁-C₈-алкилтио, C₁-C₈-галогеналкилтио, три(C₁-C₈-алкил)силила, три(C₁-C₈-алкил)силил-C₁-C₈-алкила, C₃-C₇-циклоалкила, C₃-C₇-галоциклоалкила, C₃-C₇-циклоалкенила, C₃-C₇-галоциклоалкенила, C₄-C₁₀-циклоалкилалкила, C₄-C₁₀-галоциклоалкилалкила, C₆-C₁₂-циклоалкилциклоалкила, три(C₁-C₈-алкил)силил-C₃-C₇-циклоалкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₂-C₈-алкенилокси, C₂-C₈-галогеналкенилокси, C₂-C₈-алкинилокси, C₁-C₈-алкиламино, ди-C₁-C₈-алкиламино, C₁-C₈-галогеналкиламино, ди-C₁-C₈-галогеналкиламино, C₁-C₈-алкиламиноалкила, ди-C₁-C₈-алкиламиноалкила, C₁-C₈-алкокси, C₁-C₈-галогеноалкокси, C₁-C₈-цианоалкокси, C₄-C₈-циклоалкилалкокси, C₃-C₆-циклоалкокси, C₂-C₈-алкоксиалкокси, C₁-C₈-алкилкарбонилалкокси, C₁-C₈-алкилсульфанила, C₁-C₈-галогеноалкилсульфанила, C₂-C₈-алкенилокси, C₂-C₈-галогеноалкенилокси, C₃-C₈-

алкинилокси, C₃-C₈-галогеноалкинилокси, C₁-C₈-алкилкарбонила, C₁-C₈-галогеноалкилкарбонила, C₃-C₈-циклоалкилкарбонила, C₃-C₈-галогеноциклоалкилкарбонила, C₁-C₈-алкилкарбамоила, ди-C₁-C₈-алкилкарбамоила, N-C₁-C₈-алкилоксикарбамоила, C₁-C₈-алкоксикарбамоила, N-C₁-C₈-алкил-C₁-C₈-алкоксикарбамоила, C₁-C₈-алкоксикарбонила, C₁-C₈-галогеноалкоксикарбонила, C₃-C₈-циклоалкоксикарбонила, C₂-C₈-алкоксиалкилкарбонила, C₂-C₈-галогеноалкоксиалкилкарбонила, C₃-C₁₀-циклоалкоксиалкилкарбонила, C₁-C₈-алкиламинокарбонила, ди-C₁-C₈-алкиламинокарбонила, C₃-C₈-циклоалкиламинокарбонила, C₁-C₈-алкилкарбонилокси, C₁-C₈-галогеноалкилкарбонилокси, C₃-C₈-циклоалкилкарбонилокси, C₁-C₈-алкилкарбониламино, C₁-C₈-галогеноалкилкарбониламино, C₁-C₈-алкиламинокарбонилокси, ди-C₁-C₈-алкиламинокарбонилокси, C₁-C₈-алкилоксикарбонилокси, C₁-C₈-алкилсульфинила, C₁-C₈-галогеноалкилсульфинила, C₁-C₈-алкилсульфонила, C₁-C₈-галогеноалкилсульфонила, C₁-C₈-алкиламиносульфамоила, ди-C₁-C₈-алкиламиносульфамоила, (C₁-C₈-алкоксиимино)-C₁-C₈-алкила, (C₃-C₇-циклоалкоксиимино)-C₁-C₈-алкила, гидроксиимино-C₁-C₈-алкила, (C₁-C₈-алкоксиимино)-C₃-C₇-циклоалкила, гидроксиимино-C₃-C₇-циклоалкила, (C₁-C₈-алкилимино)-окси, (C₁-C₈-алкилимино)-окси-C₁-C₈-алкила, (C₃-C₇-циклоалкилимино)-окси-C₁-C₈-алкила, (C₁-C₆-алкилимино)-окси-C₃-C₇-циклоалкила, (C₁-C₈-алкенилоксиимино)-C₁-C₈-алкила, (C₁-C₈-алкинилоксиимино)-C₁-C₈-алкила, 2-оксопирролидин-1-ила, (бензилоксиимино)-C₁-C₈-алкила, C₁-C₈-алкоксиалкила, C₁-C₈-алкилтиоалкила, C₁-C₈-алкоксиалкоксиалкила, C₁-C₈-галогеноалкоксиалкила, бензила, фенила, 5-членного гетероарила, 6-членного гетероарила, бензилокси, фенилокси, бензилсульфанила, бензиламино, фенокси, фенилсульфанила, или фениламино, причем бензил, фенил, 5-членный гетероарил, 6-членный гетероарил, 7-членный гетероарил, бензилокси или фенилокси могут быть, при необходимости, замещены одной или более группами, выбранными их вышеуказанного перечня.

Если не указано иное, определение 5-, 6- или 7-членный гетарил или гетероарил включает ненасыщенное гетероциклическое 5-7-членное кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из N, O и S: например, 2-фурил, 3-фурил, 2-тиенил, 3-тиенил, 2-пирролил, 3-пирролил, 1-пирролил, 3-пиразолил, 4-пиразолил, 5-пиразолил, 1-пиразолил, 1H-имидазол-2-ил, 1H-имидазол-4-ил, 1H-имидазол-5-ил,

1Н-имидазол-1-ил, 2-оксазолил, 4-оксазолил, 5-оксазолил, 2-тиазолил, 4-тиазолил, 5-тиазолил, 3-изоксазолил, 4-изоксазолил, 5-изоксазолил, 3-изотиазолил, 4-изотиазолил, 5-изотиазолил, 1Н-1,2,3-триазол-1-ил, 1Н-1,2,3-триазол-4-ил, 1Н-1,2,3-триазол-5-ил, 2Н-1,2,3-триазол-2-ил, 2Н-1,2,3-триазол-4-ил, 1Н-1,2,4-триазол-3-ил, 1Н-1,2,4-триазол-5-ил, 1Н-1,2,4-триазол-1-ил, 4Н-1,2,4-триазол-3-ил, 4Н-1,2,4-триазол-4-ил, 1Н-тетразол-1-ил, 1Н-тетразол-5-ил, 2Н-тетразол-2-ил, 2Н-тетразол-5-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил, 1,2,4-тиадиазол-3-ил, 1,2,4-тиадиазол-5-ил, 1,3,4-оксадиазол-2-ил, 1,3,4-тиадиазол-2-ил, 1,2,3-оксадиазол-4-ил, 1,2,3-оксадиазол-5-ил, 1,2,3-тиадиазол-4-ил, 1,2,3-тиадиазол-5-ил, 1,2,5-оксадиазол-3-ил, 1,2,5-тиадиазол-3-ил, 2-пиридинил, 3-пиридинил, 4-пиридинил, 3-пиридазинил, 4-пиридазинил, 2-пиримидинил, 4-пиримидинил, 5-пиримидинил, 2-пиразинил, 1,3,5-триазин-2-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил.

В соответствующих случаях, соединения по настоящему изобретению могут присутствовать в виде смесей различных возможных изомерных форм, в частности, стереоизомеров, например, таких стереоизомеров, как, например, Е и Z изомеры, трео- и эритро-изомеры, а также оптических изомеров, и, в соответствующих случаях, таутомеров. В объем формулы настоящего изобретения входят Е и Z изомеры, а также трео- и эритро-изомеры, оптические изомеры, любые смеси этих изомеров и любые возможные таутомерные формы.

В соответствующих случаях соединения по настоящему изобретению могут присутствовать в виде одной или нескольких форм оптических или хиральных изомеров, в зависимости от количества асимметрических центров в соединении. Таким образом, настоящее изобретение относится ко всем оптическим изомерам и к их рацемическим или скалемическим смесям (термин «скалемический» означает смесь энантиомеров в различных пропорциях) и к смесям всех возможных стереоизомеров, во всех пропорциях. Разделение диастереоизомеров и/или оптических изомеров может осуществляться в соответствии со способами, которые сами по себе известны специалистам.

В соответствующих случаях соединения по настоящему изобретению могут присутствовать в виде одной или нескольких форм геометрических изомеров, в зависимости от количества двойных связей в соединении. Таким образом, изобретение равным образом относится ко всем геометрическим изомерам и ко всем

возможным смесям, во всех пропорциях. Разделение геометрических изомеров может осуществляться в соответствии с общими способами, которые сами по себе известны специалистам.

В соответствующих случаях соединения по настоящему изобретению могут присутствовать в виде одной или нескольких форм геометрических изомеров, в зависимости от относительного положения (син/анти или цис/транс) заместителей кольца. Таким образом изобретение равным образом относится ко всем син/анти (или цис/транс) изомерам и ко всем возможным син/анти (или цис/транс) смесям, во всех пропорциях. Разделение син/анти- (или цис/транс-) изомеров может осуществляться в соответствии с общими способами, которые сами по себе известны специалистам.

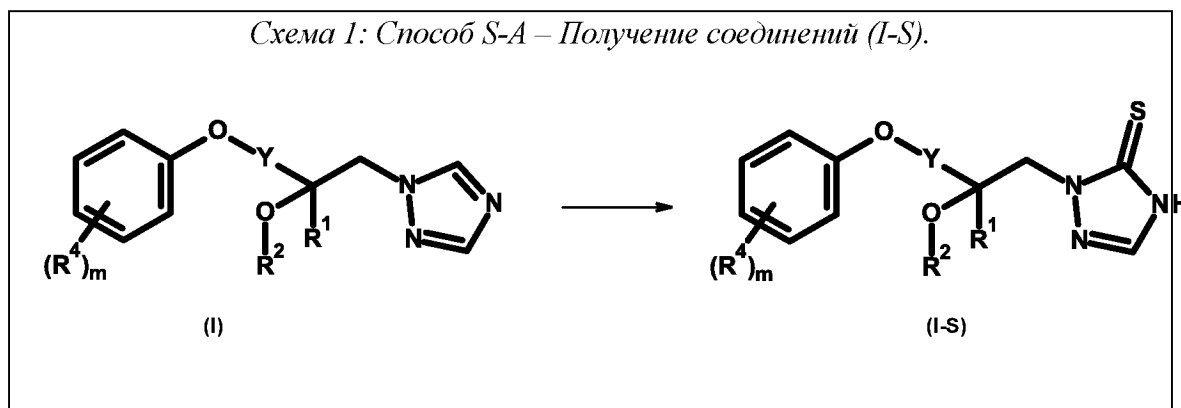
Иллюстрация способов и промежуточных соединений

Настоящее изобретение также относится к способам получения соединений формулы **(I-S)**.

Соединения формулы **(I-S)** могут быть получены различными способами по аналогии со способами, известными из уровня техники (смотрите, например, DE-A 19744706, DE-A 19617282, DE-A 19528046, WO-A 2010/146032, WO-A 2011/113820, WO-A 2012/019981, WO-A 2012/041858), а также с использованием способов получения, схематически показанных ниже и в экспериментальной части настоящей заявки. Если не указано иное, радикалы Y, R, R¹, R², R³, R⁴, m и n имеют значения, которые указаны выше для соединений формулы **(I-S)**. Эти определения применяются не только для конечных продуктов формулы **(I-S)**, но также, аналогичным образом, и для всех промежуточных соединений. Если отдельные соединения **(I-S)** не представляется возможным получить указанными способами, они могут быть получены при помощи дериватизации других соединений **(I-S)**.

Исключительно для лучшего понимания схем, приведенных ниже, спирты формулы **(I-S)** (R² = H) именуются спиртами **(I-S-H)**, несмотря на то, что общая формула **(I-S)** в соответствии с определением выше включает такие спирты **(I-S-H)**.

Способ S-A (Схема 1):

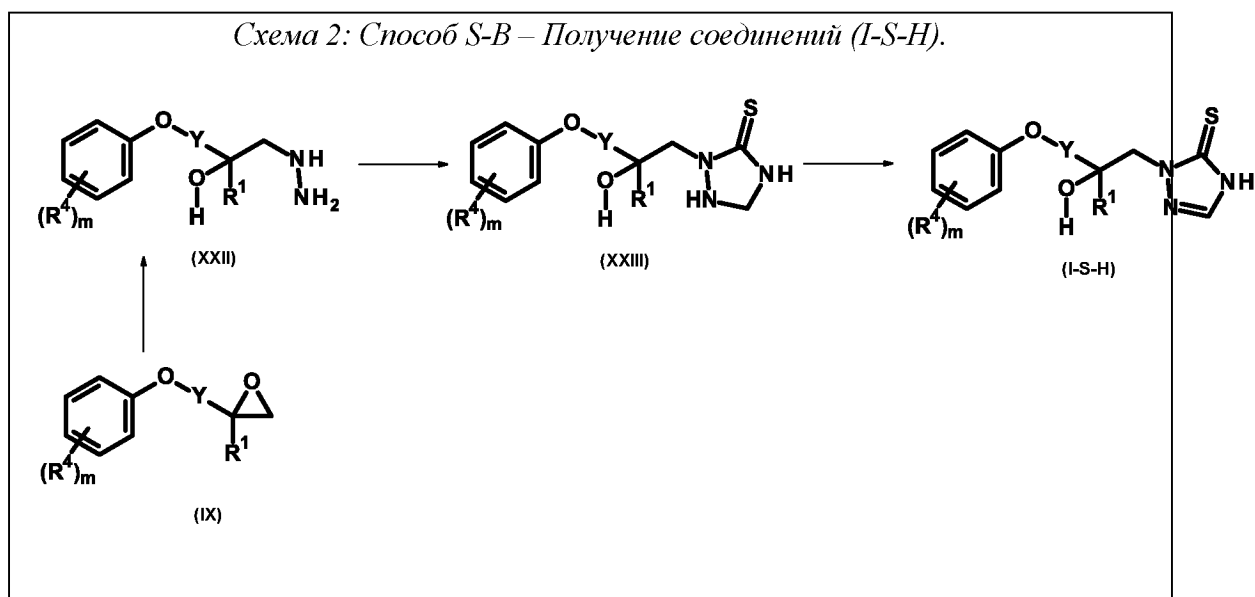


Производные триазола формулы **(I-S)** могут присутствовать в меркапто-форме или в таутомерных тионо-формах. По соображениям простоты только одну тионо-форму используют для соединения формулы **(I-S)** на Схеме 1.

Соединения **(I)**, которые могут быть получены в соответствии с описанными ниже способами, могут быть преобразованы в соответствующие соединения **(III)** с помощью способов, описанных в литературе. **(I-S)** (смотрите, например, DE-A

19744706, DE-A 19617282, DE-A 19528046, WO-A 2010/146032, WO-A 2011/113820, WO-A 2012/019981, WO-A 2012/041858). Соединения указанной общей структуры **(I)** предпочтительно реагируют с основаниями, такими как *n*-бутиллитий и диизопропиламид лития, или с реактивом Гриньяра, таким как хлорид изопропилмагния, а затем с серой. В качестве альтернативы, соединения **(I)** реагируют с серой (DE-A 19744706) при повышенных температурах, предпочтительно в растворителе, таком как DMF.

Способ S-B (Схема 2):



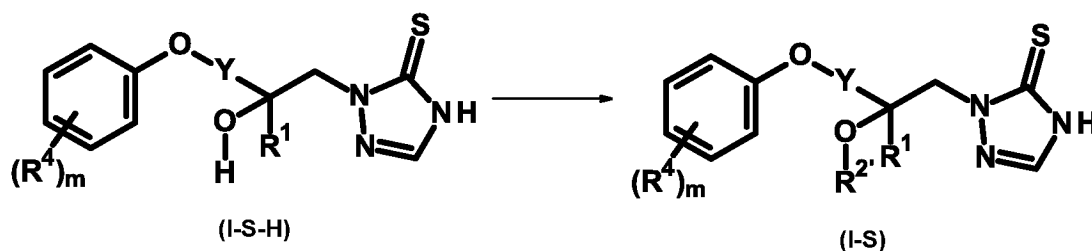
Соединения формулы **(XXIII)** и производные триазола формулы **(I-S-H)** могут присутствовать в меркапто-форме или в таутомерных тионо-формах. По соображениям простоты только одна тионо-форма показана на Схеме 2.

Соединения **(IX)**, которые могут быть получены в соответствии с описанными ниже способами, с помощью способов, описанных в литературе, могут быть преобразованы в соответствующие соединения **(I-S-H)** (см., например, WO-A 2001/46158 и ссылочные материалы). Соединения общей структуры **(IX)** предпочтительно реагируют с гидразингидратом с получением соединений **(XXII)**. Эти промежуточные соединения, при необходимости, могут быть получены в виде солей или свободных оснований, например, в виде соответствующих гидрохлоридов или соответствующих свободных гидразинов. Путем реакции соединений общей структуры **(XXII)**, при необходимости, в виде солей или свободных оснований, с формальдегидом и солью тиоцианата, например, с солью натрия, калия или аммония, могут быть получены соединения **(XXIII)**. При необходимости соединения **(XXIII)**

могут быть получены в виде солей или свободных оснований. При необходимости, реакция может осуществляться в присутствии воды. Соединения (**XXIII**) могут также быть окислены с получением соединений (**I-S-H**), предпочтительно в присутствии хлорида железа (III) и соляной кислоты.

Способ S-C (Схема 3):

Схема 3: Способ S-C – Получение соединений (I-S).



$R^{2'}$ = C_1 - C_6 -алкил, C_2 - C_6 -алкенил, C_2 - C_6 -алкинил, C_3 - C_8 -циклоалкил, C_3 - C_8 -циклоалкил- C_1 - C_4 -алкил, фенил, фенил- C_1 - C_4 -алкил, фенил- C_2 - C_4 -алкенил или фенил- C_2 - C_4 -алкинил;

причем алифатические фрагменты, за исключением циклоалкильных фрагментов, R^2 могут нести 1, 2, 3 или до максимально возможного количества одинаковых или различных групп R^a , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, фенила, C_1 - C_4 -алкокси и C_1 - C_4 -галогеналкокси, причем фенил может быть замещен 1, 2, 3, 4 или 5 заместителями, выбранными из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила, C_1 - C_4 -галогеналкокси,

и причем циклоалкильные и/или фенильные фрагменты R^2 могут нести 1, 2, 3, 4, 5 или до максимального количества одинаковых или различных групп R^b , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила и C_1 - C_4 -галогеналкокси.

Соединения формулы (**I-S-H**) и производные триазола формулы (**I-S**) могут присутствовать в меркапто-форме или в таутомерных тионо-формах. По соображениям простоты только одна тионо-форма показана на Схеме 3.

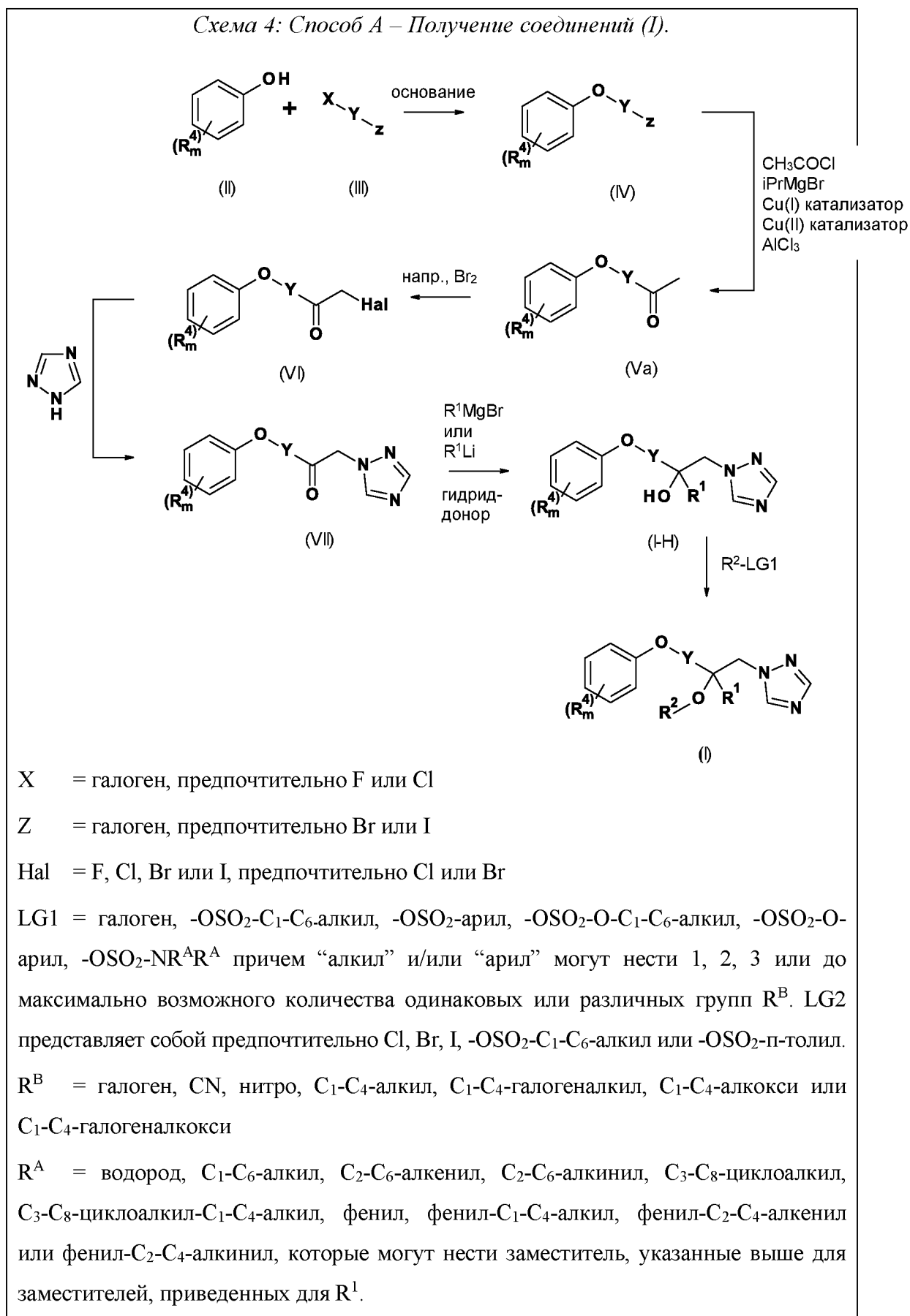
Соединения (**I-S-H**), которые могут быть получены в соответствии со Способом S-B могут быть преобразованы с помощью способов, описанных в литературе, в соответствующие соединения (**I-S**) (смотрите, например, DE-A 3202604, JP-A 02101067, EP-A 225739, CN-A 101824002, FR-A 2802772). Соединения

указанной общей структуры (**I-S-H**) предпочтительно вступают в реакцию с алкилгалидами, диалкилсульфатами, ангидридами, хлорангидридами, фосфорилхлоридом или алкилизоцианатом, предпочтительно в присутствии основания с получением соединений (**I-S**).

Соединения формулы (**I**) могут быть получены различными способами по аналогии со способами, известными из уровня техники (смотрите, например, J. Agric. Food Chem. (2009) 57, 4854-4860; EP-A 0 275 955; DE-A 40 03 180; EP-A 0 113 640; EP-A 0 126 430; WO-A 2013/007767 и ссылочные материалы), а также с использованием способов получения, схематически показанных ниже и в экспериментальной части настоящей заявки. Если отдельные соединения (**I**) не представляется возможным получить указанными способами, они могут быть получены при помощи дериватизации других соединений(**I**).

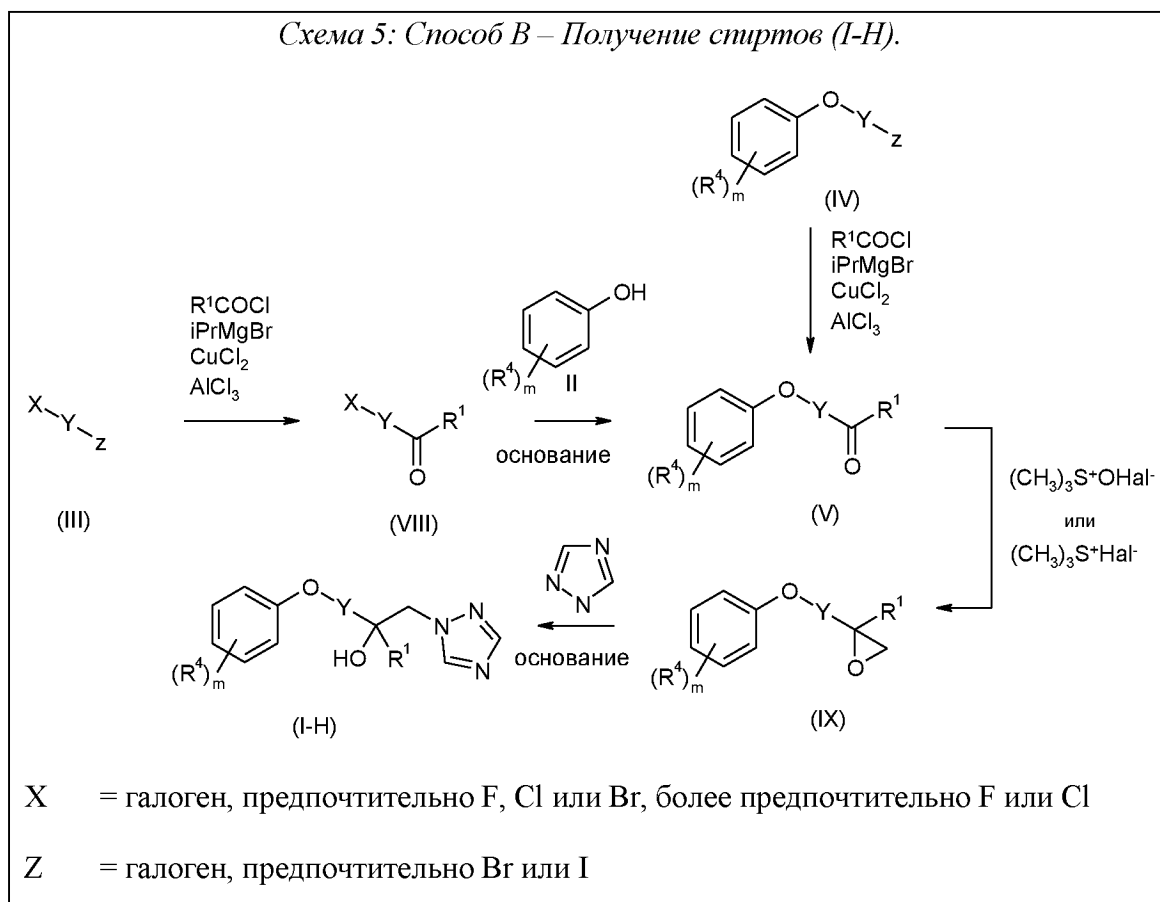
Исключительно для лучшего понимания схем, приведенных ниже, спирты формулы (**I**) ($R^2 = H$) именуются спиртами (**I-H**), несмотря на то, что общая формула (**I**) в соответствии с определением выше включает такие спирты (**I-H**).

Способ А (Схема 4):



С помощью способов, описанных в литературе, соединения **(II)** и **(III)** (Схема 1a) могут быть преобразованы в соответствующие соединения **(IV)**, а затем в соединения **(Va)**, **(VI)**, **(VII)**, **(I-H)** и **(I)** (см. WO-A 2013/007767). Фенолы **(II)** вступают в реакцию с арилами **(III)**, где X означает F или Cl, а Z означает Br или I. Z представляет собой, в частности, Br, и реакцию, при необходимости, проводят в присутствии основания с получением соединений **(IV)**. Эти промежуточные соединения, в частности, где Z представляет собой Br, затем преобразуются в реактивы Гриньяра путем реакции с магнием или реакции трансметаллирования с такими реагентами, как галогениды изопропилмагния, а затем вступают в реакцию с ацетилхлоридом с получением ацетофенонов **(Va)**. Эти реакции предпочтительно проводят в безводных условиях и в присутствии катализатора, такого как CuCl, CuCl₂, AlCl₃, LiCl и их смеси. Соединения **(Va)** могут быть галогенированы на следующем этапе, например, при помощи Cl₂ или Br₂ с целью получения α-галокетонов **(VI)**. Реакции предпочтительно проводят в органическом растворителе, таком как диэтиловый эфир, метил-трет-бутиловый эфир, метанол или уксусная кислота. Галоген в α-позиции, предпочтительно Cl или Br, может быть впоследствии замещен на 1,2,4-триазол. При необходимости, это преобразование выполняют в присутствии основания, такого как Na₂CO₃, K₂CO₃, Cs₂CO₃, NaOH, KOtBu, NaNH или их смесей, предпочтительно в присутствии органического растворителя, такого как тетрагидрофуран, диметилформамид или толуол. Кетоны **(VII)** затем вступают в реакцию с нуклеофильными субстратами, такими как реактивы Гриньяра R¹MgBr или литийорганические соединения R¹Li или гидрид-донор, такой как борогидрид натрия, с получением спиртов **(I-H)**. Эти трансформации предпочтительно выполняют в безводных условиях, в некоторых случаях в присутствии кислоты Льюиса, такой как LaCl₃·2LiCl или MgBr₂·OEt₂. После дальнейшей дериватизации спирта **(I-H)** с алкилирующим агентом R²-LG можно получить соединения общей формулы **(I)**. LG представляет собой замещаемую группу, такую как галоген, алкилсульфонил, алкилсульфонилокси и арилсульфонилокси, предпочтительно Br, I и метилсульфонилокси. Эти реакции дериватизации, при необходимости, выполняют в присутствии основания, такого как NaNH, а также в присутствии органического растворителя, такого как тетрагидрофуран.

Способ В (Схема 5):

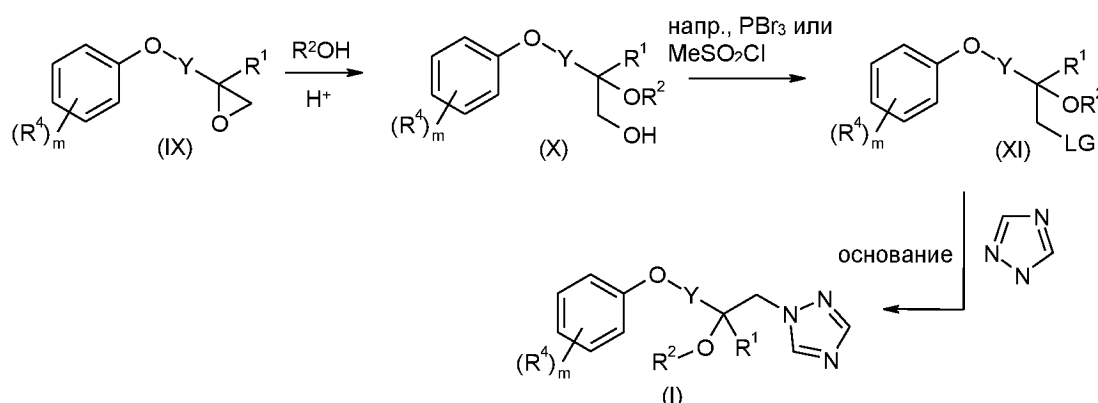


Соединения общей структуры (III), в частности, где Z представляет собой Br, преобразуют в реактивы Гриньяра путем реакции с магнием или реакции трансметаллирования с такими реагентами, как галогениды изопропилмагния, а затем вступают в реакцию с ацилхлоридами с получением кетонов (VII). Эти реакции предпочтительно проводят в безводных условиях и в присутствии катализатора, такого как CuCl_2 , AlCl_3 , LiCl и их смеси. Кетоны (VIII) затем реагируют с фенолами (II), при необходимости, в присутствии основания, такого как K_2CO_3 или Cs_2CO_3 , а также растворителя, такого как DMF (диметилформамид), с получением соединений (V). В качестве альтернативы, соединения (V) можно получить за счет реакции (IV) с магнием или с реагентами трансметаллирования, после чего выполняют реакцию с хлористыми ацилами R^1COCl . Эти реакции предпочтительно проводят в безводных условиях и в присутствии катализатора, такого как CuCl_2 , AlCl_3 , LiCl и их смеси, при этом Z представляет собой предпочтительно Br. Затем промежуточные соединения (V) могут быть преобразованы с помощью способов, описанных в литературе, в соответствующие эпоксиды (IX) (смотрите, например, EP-A 461 502, DE-A 33 15 681, EP-A 291 797,

WO-A 2013/007767). Промежуточные соединения (V) предпочтительно вступают в реакцию с солями триметилсульфоксония или триметилсульфония, которые могут быть получены непосредственно в реакционной смеси, предпочтительно галогенидами триметилсульфоксония, галогенидами триметилсульфония, метилсульфатами триметилсульфоксония или метилсульфатами триметилсульфония, предпочтительно в присутствии основания, такого как гидроксид натрия. Эпоксиды (IX) могут впоследствии реагировать с 1,2,4-триазолом с получением соединений (I-H). При необходимости, это преобразование выполняют в присутствии основания, такого как Na_2CO_3 , K_2CO_3 , Cs_2CO_3 , NaOH , KOtBu , NaN или их смесей, предпочтительно в присутствии органического растворителя, такого как тетрагидрофуран, диметилформамид или толуол.

Способ С (Схема 6):

Схема 6: Способ С – Получение соединений (I).



LG = галоген, $-\text{OSO}_2\text{-C}_1\text{-C}_6\text{-алкил}$, $-\text{OSO}_2\text{-арил}$, $-\text{OSO}_2\text{-O-C}_1\text{-C}_6\text{-алкил}$, $-\text{OSO}_2\text{-O-арил}$, $-\text{OSO}_2\text{-NR}^A\text{R}^A$ причем “алкил” и/или “арил” могут нести 1, 2, 3 или до максимально возможного количества одинаковых или различных групп R^D , предпочтительно Cl, Br, I, $-\text{OSO}_2\text{-C}_1\text{-C}_6\text{-алкил}$ или $-\text{OSO}_2\text{-п-толил}$, более предпочтительно Cl, Br, I или $-\text{OSO}_2\text{-C}_1\text{-C}_2\text{-алкил}$.

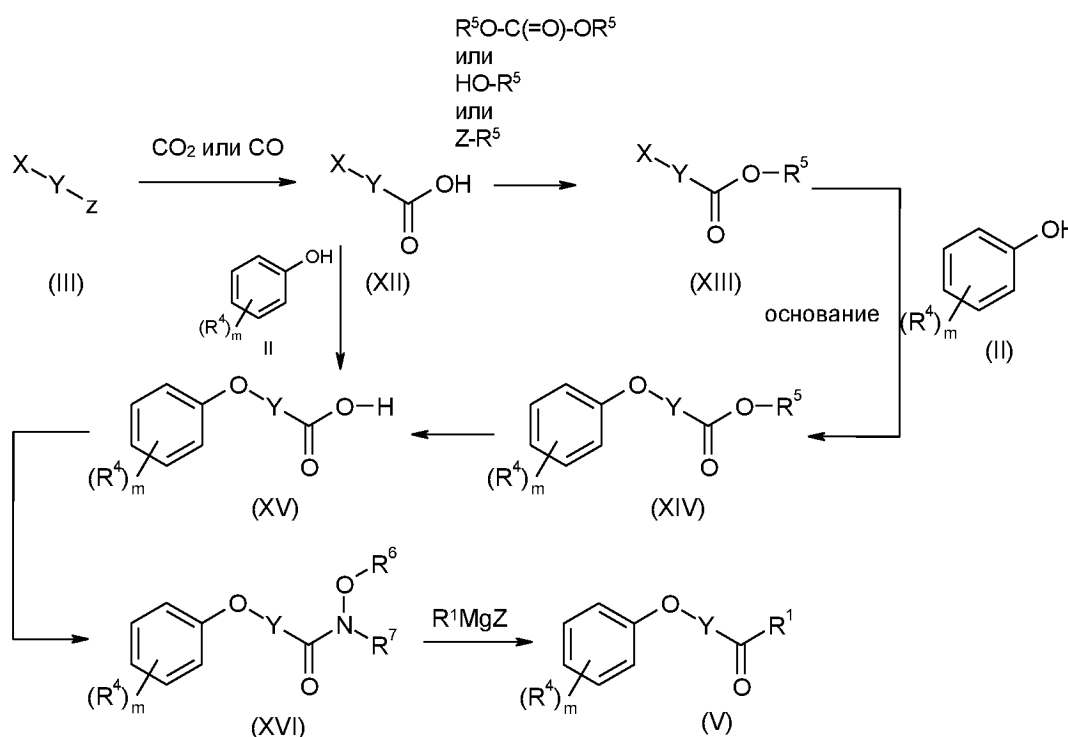
R^D = галоген, CN, нитро, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-галогеналкил}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкокси}$ или $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-галогеналкокси}$

R^A = водород, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкил}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-алкенил}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-алкинил}$, $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-циклоалкил}$, $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-циклоалкил-C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$, фенил, фенил- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$, фенил- $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкенил}$ или фенил- $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкинил}$, которые могут нести заместители, указанные выше для заместителей, приведенных для R^1 .

Эпоксиды общей структуры **(IX)** могут реагировать со спиртами R^2OH с получением спирта **(X)**. Предпочтительно эту трансформацию выполняют в присутствии кислоты. Впоследствии спирт **(X)** подготавливают к реакции нуклеофильного замещения. Таким же образом функциональная группа спирта в соединении **(X)** реагирует с галогенирующими агентами или агентами сульфонирования, такими как PBr_3 , PCl_3 , $MeSO_2Cl$, тозилхлорид или тионилхлорид, с получением соединений **(XI)**. Затем промежуточные соединения **(XI)** могут реагировать с 1,2,4-триазолом с получением соединений **(I)**. При необходимости, это преобразование выполняют в присутствии основания, такого как Na_2CO_3 , K_2CO_3 , Cs_2CO_3 , $NaOH$, $KOtBu$, NaN или их смесей, предпочтительно в присутствии органического растворителя, такого как тетрагидрофуран, диметилформамид или толуол.

Способ D (Схема 7):

Схема 7: Способ D – Получение промежуточных соединений (V).



X = галоген, предпочтительно F или Cl

Z = галоген, предпочтительно Cl, Br или I, более предпочтительно Br или I

R^5 = C_1 - C_6 -алкил, C_3 - C_8 -циклоалкил или арил

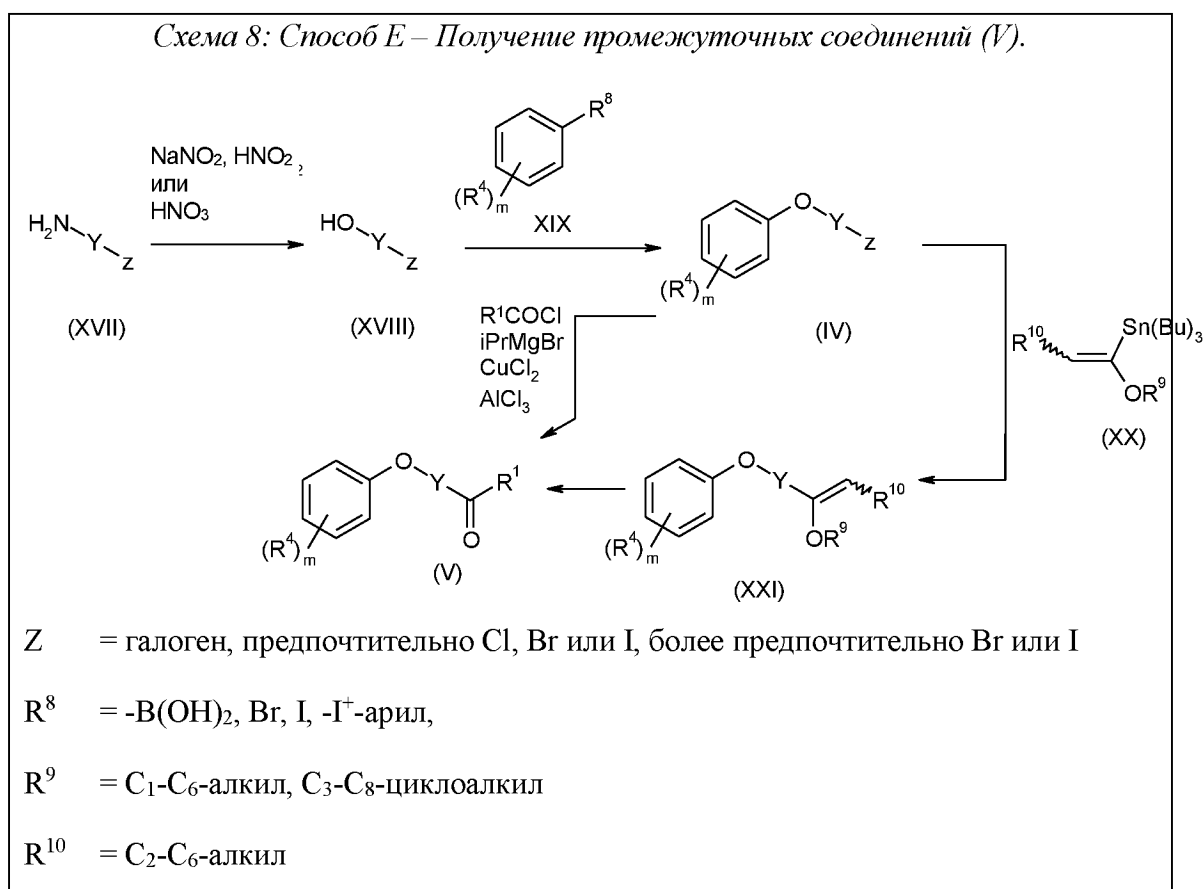
R^6, R^7 = независимо C_1 - C_6 -алкил или C_3 - C_8 -циклоалкил

С помощью способов, описанных в литературе, соединения **(III)** могут быть преобразованы в соответствующие соединения **(XII)**, а затем в соединения **(XIII)**, **(XIV)**, **(XV)**, **(XVI)** и **(V)**. В качестве альтернативы, один или несколько этапов реакции можно опустить. Особенно это актуально, если некоторые защитные группы не имеют решающего значения и за счет этого способ D можно укоротить (например, **(XII)** → **(XV)**).

Соединения **(III)**, в которых X обозначает F или Cl, а Z обозначает Cl, Br или I, при необходимости, вступают в реакцию с диоксидом углерода или солями муравьиной кислоты с получением соединений **(XII)**. Эту трансформацию выполняют в присутствии реагентов и катализаторов, таких как литий, магний, н-бутиллитий, метиллитий или никель (например, Organic & Biomolecular Chemistry (Органическая и биомолекулярная химия, 8(7), 1688-1694; 2010; WO-A 2003/033504; Organometallics (Металлоорганические соединения), 13(11), 4645-7; 1994 и ссылочные материалы). В качестве альтернативы, соединение **(III)** вступает в реакцию гидроксикарбонилизации с монооксидом углерода или с солью муравьиной кислоты, предпочтительно в присутствии катализатора, такого как Pd(OAc)₂ и Co(OAc)₂ (например, Dalton Transactions, 40(29), 7632-7638; 2011; Synlett, (11), 1663-1666; 2006 и приведенные в этом документе ссылки).

Затем кислоты **(XII)** вступают в реакцию с ангидридами R⁵O-C(=O)-OR⁵, спиртами HO-R⁵ или галоидалкилами Z-R⁵ с получением эфира общей структуры **(XIII)** (см., например, российский «Журнал общей химии», 70 (9), 1371-1377, 2000; «Журнал химического общества Японии», 76 (8), 1645-1667, 2003). Реакции предпочтительно выполняют в присутствии связывающего реагента, такого как диалкилкарбодиимид (CDI) или диэтилазодикарбоксилат (DEAD) и/или основания, такого как триэтиламин или диметиламинпиридин (DMAP). В некоторых случаях, соответствующие хлориды кислот образуются до проведения реакции со спиртами HO-R⁵ (например, WO-A 2007/059265). Эфир **(XIII)** впоследствии вступает в реакцию с фенолами **(II)**, при необходимости, в присутствии основания, такого как K₂CO₃, Cs₂CO₃, NEt₃ или DABCO, а также растворителя, такого как DMF, с получением соединений **(XIV)**. Следующая реакция гидролиза может выполняться в присутствии кислоты, такой как H₂SO₄, HNO₃ или рсульфоновая кислота, или в присутствии основания, такого как KOH, с получением кислоты **(XV)**. Впоследствии основание **(XV)** может вступать в реакцию с алкоксиалкиламином, предпочтительно

с метоксиметиламином. Соответствующая реакция может осуществляться в присутствии таких реагентов как карбодиимиды (например, WO-A 2011/076744), диимидазолил кетон CDI, N-алкокси-N-алкилкарбамоил хлориды (например, Bulletin of the Korean Chemical Society 2002, 23, 521-524), S,S-ди-2-пиридил дитиокарбонаты (например, Bulletin of the Korean Chemical Society 2001, 22, 421-423), трихлорметил хлорформат (например, Synthetic communications 2003, 33, 4013-4018) или пептидные связующие реагенты HATU. Промежуточные соединения (**V**) можно получить после реакции амидов Вайнреба (**XVI**) с галогенидами магния R_1MgZ , такими как метилмагнийбромид, метилмагнийхлорид или этилмагнийбромид, предпочтительно в растворителе, таком как THF.

Способ Е (Схема 8):

С помощью способов, описанных в литературе, амины **(XVII)** могут быть преобразованы в соответствующие спирты **(XVIII)**. (например, Journal of Medicinal Chemistry 1999, 42, 95-108; WO-A 2007/017754; WO-A 2007/016525; Tetrahedron let. 2003, 44, 725-728), предпочтительно в присутствии серной кислоты или соляной кислоты, а также NaNO₂. Затем спирты **(XVIII)** могут быть преобразованы в соединения общей структуры **(IV)** с помощью способов, описанных в литературе (например, Chemistry – A European Journal 2012, 18, 1414014149; Organic Letters 2011, 13, 1552-1555; Synlett 2012, 23, 101-106; WO-A 2005/040112; Organic Letters 2007, 9, 643-646; WO-A 2009/044160 и приведенные в этом документе ссылки). Соединения **(XIX)** могут, например, быть представлены арилиодидами, которые в некоторых случаях до начала реакции преобразуют в соли диарилиодония, арилбромиды или –иодидами, которые предпочтительно вступают в реакцию в присутствии катализатора, такого как Cu или CuI, или арилбориновые кислоты или эфиры, которые предпочтительно вступают в реакцию в присутствии катализатора, такого как Cu(OAc)₂. Соединения **(IV)** могут вступать в реакцию с олововодородом, таким как **(XX)**, в присутствии катализатора на основе металла переходной группы, такого

как $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$, $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$, PdCl_2 или CuI (например, WO-A 2011/126960; WO-A 2011/088025; Journal of Organic Chemistry 1997, 62, 2774-2781; WO-A 2005/019212). Соединения **(XXI)** могут впоследствии подвергаться гидролизу с получением соединений **(V)**, причем в качестве R^1 здесь выступает $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкил, предпочтительно в присутствии кислоты, такой как HCl или H_2SO_4 (например, Journal of Organic Chemistry 1990, 55, 3114-3118). В качестве альтернативы, соединения **(V)** можно получить за счет реакции **(IV)** с магнием или с реагентами трансметаллирования, после чего выполняют реакцию с хлористыми ацилами R^1COCl . Эти реакции предпочтительно проводят в безводных условиях и в присутствии катализатора, такого как CuCl_2 , AlCl_3 , LiCl и их смеси, при этом Z представляет собой предпочтительно Br .

Общие положения

Способы S-A – S-C и A – E для получения соединений формулы **(I-S)** и их промежуточных соединений, при необходимости, осуществляют с использованием одного или нескольких вспомогательных веществ для реакции.

В качестве применимых вспомогательных веществ при реакции могут быть использованы, в соответствующих случаях, неорганические или органические основания или акцепторы кислоты. Предпочтительно они включают ацетаты, амиды, карбонаты, гидрокарбонаты, гидриды, гидроксиды или алкоксиды щелочных или щелочноземельных металлов, например, ацетат натрия, ацетат калия или ацетат кальция, амид лития, амид натрия, амид или амид кальция, карбонат натрия, карбонат калия или карбонат кальция, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия или гидрокарбонат кальция, гидрид лития, гидрид натрия, гидрид калия или гидрид кальция, гидроксид лития, гидроксид натрия, гидроксид калия или гидроксид кальция, *n*-бутиллитий, втор-бутиллитий, трет-бутиллитий, литий диизопропиламид, литий бис(триметилсилил)амид, натрий метоксид, этоксид, *n*- или изо-пропоксид, *n*-, изо-, *s*- или *t*-бутоксид или калий метоксид, этоксид, *n*- или изо-пропоксид, *n*-, изо-, *s*- или *t*-бутоксид; а также основные органические соединения азота, например, триметиламин, триэтиламин, трипропиламин, трибутиламин, этилдиизопропиламин, *N,N*-диметилциклогексиламин, дициклогексиламин, этилдициклогексиламин, *N,N*-диметиланилин, *N,N*-диметилбензиламин, пиридин, 2-метил-, 3-метил-, 4-метил-, 2,4-диметил-, 2,6-диметил-, 3,4-диметил- и 3,5-диметилпиридин, 5-этил-2-метилпиридин, 4-

диметиламинопиридин, N-метилпиперидин, 1,4-диазабицикло[2.2.2]-октан (DABCO), 1,5-диазабицикло[4.3.0]-нон-5-ен (DBN) или 1,8-диазабицикло[5.4.0]-ундец-7-ен (DBU).

В качестве применимых вспомогательных веществ при реакции могут быть использованы, в соответствующих случаях, неорганические или органические кислоты. Предпочтительно они включают неорганические кислоты, например, фторид водорода, хлорид водорода, бромид водорода и иодид водорода, серную кислоту, ортофосфорную кислоту и азотную кислоту, а также соли кислот, такие как NaHSO_4 и KHSO_4 , или органические кислоты, например, муравьиную кислоту, карбоновую кислоту и алкановые кислоты, такие как уксусная кислота, трифторуксусная кислота, трихлоруксусная кислота и пропионовая кислота, а также гликолевая кислота, тиоциановая кислота, молочная кислота, янтарная кислота, лимонная кислота, бензойная кислота, коричная кислота, щавелевая кислота, насыщенные или моно- или диненасыщенные $\text{C}_6\text{-C}_{20}$ жирные кислоты, алкилсерные моноэфиры, алкилсульфоновые кислоты (сульфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 – 20 атомами углерода), арилсульфоновые кислоты или арилдисульфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут одну или две группы сульфоновой кислоты), алкилфосфоновые кислоты (фосфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 - 20 атомами углерода), арилфосфоновые кислоты или арилдифосфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут один или два радикала фосфоновой кислоты), где алкил- и арил- радикалы могут нести дополнительные заместители, например, п-толуолсульфоновая кислота, салициловая кислота, п-аминосалициловая кислота, 2-феноксibenзойная кислота, 2-ацетоксибензойная кислота и т.д.

Способы S-A – S-C и A – E, при необходимости, осуществляют с использованием одного или нескольких разбавителей. В сущности, применимыми разбавителями являются все инертные органические растворители. Если не указано иное для вышеописанных способов S-A – S-C и A – E, такие разбавители предпочтительно включают алифатические и ароматические, при необходимости, галогенизированные углеводороды, такие как пентан, гексан, гептан, циклогексан, петролейный эфир, бензин, лигроин, бензол, толуол, ксилол, метилхлорид,

этиленхлорид, хлороформ, тетрахлорметан, хлорбензол и о-дихлорбензол, простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, дибутиловый эфир и метил-трет-бутиловый эфир, диметиловый эфир гликоля и диметиловый эфир дигликоля, тетрагидрофуран и диоксан, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизопропилкетон и метилизобутилкетон, сложные эфиры, такие как метилацетат и этилацетат, нитрилы, например, ацетонитрил и пропионитрил, амиды, например, диметилформамид, диметилацетамид и N-метилпирролидон, а также диметилсульфоксид, тетраметиленсульфон и гексаметилфосфорамид и DMPU.

В способах реакционные температуры могут варьироваться в пределах относительно широкого диапазона. В целом, используются температуры в диапазоне -78°C – 250°C , предпочтительно температуры в диапазоне -78°C - 150°C .

Время реакции варьируется в зависимости от масштаба реакции и температуры реакции, но, как правило, оно составляет от нескольких минут, например, от 5 мин., до 48 ч.

Способы, как правило, осуществляют при нормальном давлении. Однако также возможно, чтобы способы по изобретению осуществлялись при повышенном или пониженном давлении.

Для осуществления способов по изобретению необходимые в каждом случае исходные материалы, как правило, используются приблизительно в эквимоларных количествах. Однако также возможно, чтобы один из компонентов, используемых в каждом случае, использовался в относительно большом избытке.

После завершения реакции соединения в реакционной смеси, при необходимости, сепарируют с использованием одного из обычных методов сепарации. При необходимости, соединения подвергаются очистке путем рекристаллизации или хроматографии.

В соответствующих случаях, в способах S-A – S-C и A – E по изобретению могут быть использованы также соли и/или N-оксиды исходных соединений.

Соединения формулы (I-S) и их промежуточные соединения могут быть преобразованы в физиологически приемлемые соли такие, например, как кислотные аддитивные соли или комплексы металлических солей.

В зависимости от свойств вышеуказанных заместителей соединения формулы (I-S) обладают кислотными или основными свойствами и могут образовывать соли, при необходимости, также внутренние соли или аддукты с неорганическими или органическими кислотами или с основаниями, или с ионами металлов. Если соединения формулы (I-S) несут амино, алкиламино или другие группы, которые придают основные свойства, эти соединения могут вступать в реакцию с кислотами с получением солей, или они могут быть непосредственно получены в виде солей в результате синтеза. Если соединения формулы (I-S) несут гидроксильную, карбоксильную или другие группы, придающие кислотные свойства, эти соединения могут вступать в реакцию с основаниями с получением солей. Пригодными основаниями являются, например, гидроксиды, карбонаты, бикарбонаты щелочных и щелочноземельных металлов, в частности, натрия, калия, магния и кальция, также аммиака, первичных, вторичных и третичных аминов с (C₁-C₄)-алкил группами, моно-, ди- и триалканоламины (C₁-C₄)-алканолов, холин, а также хлорхолин.

Соли, которые можно получить таким путем, также обладают фунгицидными свойствами.

Примерами неорганических кислот являются галогенводородные кислоты, такие как фторводород, хлороводород, бромоводород и иодоводород, серная кислота, ортофосфорная кислота и азотная кислота, а также соли кислот, такие как NaHSO₄ и KHSO₄. Пригодными органическими кислотами являются, например, муравьиная кислота, карбоновая кислота и алкановые кислоты, такие как уксусная кислота, трифторуксусная кислота, трихлоруксусная кислота и пропионовая кислота, а также гликолевая кислота, тиоциановая кислота, молочная кислота, янтарная кислота, лимонная кислота, бензойная кислота, коричная кислота, малеиновая кислота, фумаровая кислота, винная кислота, сорбиновая кислота, щавелевая кислота, алкилсульфоновые кислоты (сульфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 - 20 атомами углерода), арилсульфоновые кислоты или арилдисульфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут одну или две группы сульфоновой кислоты), алкилфосфоновые кислоты (фосфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 - 20 атомами углерода), арилфосфоновые кислоты или арилдифосфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут один или два

радикала фосфоновой кислоты), где алкил- и арил- радикалы могут нести дополнительные заместители, например, п-толуолсульфоновая кислота, 1,5-нафталиндисульфоновая кислота, салициловая кислота, п-аминосалициловая кислота, 2-феноксibenзойная кислота, 2-ацетоксибензойная кислота и т.д.

Пригодными ионами металлов являются, в частности, ионы элементов второй группы главной подгруппы, в частности, кальций и магний, третьей и четвертой группы главной подгруппы, в частности, алюминий, олово и свинец, а также элементы побочных подгрупп групп с первой по восьмую, в частности, хром, марганец, железо, кобальт, никель, медь, цинк и другие. Особенно предпочтительными являются ионы металлов четвертого периода. В данном случае, металлы могут присутствовать в разных валентностях, которые они могут иметь.

Кислотно-аддитивные соли соединений формулы (I-S) могут быть получены простыми способами с применением обычных методов, например, путем растворения соединения формулы (I-S) в соответствующем инертном растворителе и добавления кислоты, например, соляной кислоты, и выделены известными способами, например, путем фильтрации и, при необходимости, очищены путем промывки инертным органическим растворителем.

Соответствующими анионами солей являются анионы, предпочтительно полученные из следующих кислот: галогенводородные кислоты, такие, например, как соляная кислота и бромистоводородная кислота, а также фосфорная кислота, азотная кислота и серная кислота.

Комплексы металлических солей соединений формулы (I-S) могут быть получены простыми способами с применением обычных процессов, например, путем растворения соли металла в спирте, например, этаноле и добавления раствора к соединению формулы (I-S). Комплексы металлических солей могут быть изолированы известными способами, например, путем фильтрации, и, при необходимости, могут быть очищены путем рекристаллизации.

Соли промежуточных соединений также могут быть получены в соответствии со способами, указанными выше для солей соединений формулы (I-S).

N-оксиды соединений формулы (I-S) или их промежуточных соединений могут быть получены простыми способами с применением обычных процессов, например, путем N-окисления с перекисью водорода (H_2O_2), надкислотами,

например, надсерной кислотой, или пероксикарбоновыми кислотами, такими как мета-хлорпероксибензойная кислота или пероксомonosерная кислота (кислота Каро).

Например, соответствующие N-оксиды могут быть получены с использованием в качестве исходных соединений соединения (I-S) с применением традиционных методов окисления, например, за счет обработки соединений (I-S) органической перкислотой, такой как метахлорпербензойная кислота (например, WO-A 2003/64572 или J. Med. Chem. 38 (11), 1892-1903, 1995); или неорганическими окислительными агентами, такими как пероксид водорода (например, J. Heterocyc. Chem. 18 (7), 1305-1308, 1981) или оксоном (например, J. Am. Chem. Soc. 123 (25), 5962-5973, 2001). В результате окисления могут получиться чистые моно-N-окислы или смесь разных N-оксидов, которые можно разделить традиционными методами, такими как хроматография.

Композиция /препаративная форма

Настоящее изобретение также относится к композиции/препаративной форме для защиты посевов для борьбы с вредоносными микроорганизмами, в частности, с вредными грибами и бактериями, содержащим эффективное и не фитотоксичное количество активных ингредиентов по изобретению. Такими композициями предпочтительно являются фунгицидные композиции, содержащие агрономически приемлемые вспомогательные вещества, такие как растворители, носители, ПАВ или наполнители.

В контексте настоящего изобретения термин «борьба с вредоносными микроорганизмами» означает снижение заражения вредоносными микроорганизмами, которое оценивается как эффективность фунгицидного действия, по сравнению с необработанным растением, предпочтительно снижение на 25 - 50 % по сравнению с необработанным растением (100 %), более предпочтительно снижение на 40 - 79 % по сравнению с необработанным растением (100 %); еще более предпочтительно заражение вредоносными микроорганизмами полностью подавляется (на 70 - 100 %). Такая борьба может включать применение соединения в качестве лекарственного средства, т.е. для лечения уже зараженных растений, или в качестве профилактического средства, для защиты растений, которые еще не были заражены.

Выражение «эффективное нефитотоксичное количество» означает количество композиции по настоящему изобретению, которое достаточно эффективно для борьбы с грибковым заболеванием растения или для полного устранения грибкового заболевания, и которое при этом не вызывает каких бы то ни было заметных симптомов фитотоксичности. В целом, такая дозировка может варьироваться в относительно широком диапазоне. Это зависит от нескольких факторов, например, от какого вида гриба осуществляется защита, от вида растения, от климатических условий и от ингредиентов композиций по изобретению.

Применимые органические растворители включают все полярные и неполярные органические растворители, используемые обычно для целей получения препаратов. Предпочтительные растворители выбраны из кетонов, например, метилизобутилкетона и циклогексанона, амидов, например, диметилформамида и амидов алканкарбоновой кислоты, например, N,N-диметилдеканамида и N,N-диметилоктанамида, также, циклических растворителей, например, N-метил-пирролидона, N-октил-пирролидона, N-додецил-пирролидона, N-октил-капролактама, N-додецил-капролактама и бутиролактона, также сильных полярных растворителей, например, диметилсульфоксида, и ароматических углеводородов, например, ксилол, Solvesso™, минеральных масел, например, уайт-спирита, нефти, алкилбензолов и веретенного масла, также сложных эфиров, например, монометилового эфира пропиленгликоля, дибутилового эфира адипиновой кислоты, гексилового эфира уксусной кислоты, гептилового эфира уксусной кислоты, три-н-бутилового эфира лимонной кислоты и ди-н-бутилового эфира фталевой кислоты, а также спиртов, например, бензилового спирта и 1-метокси-2-пропанола.

В соответствии с настоящим изобретением носителем является природное или синтетическое, органическое или неорганическое вещество, с которым смешиваются или объединяются активные ингредиенты для улучшения их применимости, в частности, для обработки растений или частей растения, или семян. Носитель, который может представлять собой твердое или жидкое вещество, как правило, является инертным и должен быть применимым в сельском хозяйстве.

Подходящие твердые или жидкие носители включают, например: соли аммония и порошки естественных пород, такие как каолины, глиноземы, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовую землю, и синтетические рудничные муки как, например, мелкодисперсный оксид кремния, окись алюминия

и природные или синтетические силикаты, смолы, воски, твердые удобрения, воду, спирты, в частности, бутанол, органические растворители, минеральные и растительные масла, а также их производные. Могут быть использованы также смеси таких носителей.

Применимые твердые наполнители и носители включают неорганические дисперсные материалы, например, карбонаты, силикаты, сульфаты и оксиды со средним размером частиц 0,005 - 20 мкм, предпочтительно 0,02 - 10 мкм, например, сульфат аммония, фосфат аммония, мочевины, карбонат кальция, сульфат кальция, сульфат магния, оксид сульфат, оксид алюминия, диоксид кремния, так называемая тонкодисперсная двуокись кремния, силикагели, природные или синтетические силикаты, и алюмосиликаты и растительные продукты, такие как зерновая мука, древесная мука/опилки и целлюлозный порошок.

Подходящие твердые носители для гранул включают, например: разломанные и фракционированные естественные породы, такие как, например, кальцит, мрамор, пемза, сепиолит, доломит, а также синтетические грануляты из неорганических и органических мук и грануляты из органического материала, например, опилки, скорлупа кокосового ореха, початков кукурузы и стеблей табака.

Подходящими сжиженными газовыми наполнителями или носителями являются жидкости, которые при обычной температуре и обычном давлении находятся в газообразном состоянии, например, аэрозольные пропелленты, такие как галогенуглеводороды, а также бутан, пропан, азот и диоксид углерода.

Могут быть использованы усилители клейкости, такие как карбоксиметилцеллюлоза, натуральные и синтетические полимеры в виде порошков, гранул или латекса, такого как гуммиарабик, поливиниловый спирт и поливинилацетат, а также натуральные фосфолипиды, например, цефалины и лецитины, синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут являться минеральные или растительные масла.

Если в качестве наполнителя используется вода, то возможно использование, например, органических растворителей в качестве вспомогательных. Подходящими жидкими растворителями являются, преимущественно: ароматические соединения, такие как ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные ароматические и хлорированные алифатические углеводороды, такие как хлорбензолы, хлорэтилены

или дихлорметан, алифатические углеводороды, такие как циклогексан или парафины, например, фракции нефти, минеральные и растительные масла, спирты, такие как бутанол или гликоль и также их простые эфиры и сложные эфиры, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, сильно полярные растворители, такие как диметилформамид и диметилсульфоксид, а также вода.

Применимые поверхностно-активные вещества (адъюванты, эмульгаторы, дисперсанты, защитные коллоиды, увлажняющие реагенты и связывающие вещества) включают все обычные ионные и неионные ПАВ, например, этоксилированные нонилфенолы, эфир полиэтиленгликоля линейных или разветвленных спиртов, продукты реакции алкилфенолов с этиленоксидом и/или пропиленоксидом, продукты реакции аминов жирных кислот с этиленоксидом и/или пропиленоксидом, также сложные эфиры жирных кислот, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, алкилсульфаты простых эфиров, алкилфосфаты простых эфиров, арилсульфаты, этоксилированные арилалкилфенолы, например, тристирил-фенол-этоксилаты, также этоксилированные и пропоксилированные арилалкилфенолы, такие как сульфатированные или фосфатированные арилалкилфенол-этоксилаты и -этокси- и -пропоксилаты. Другими примерами являются природные и синтетические, водорастворимые полимеры, например, лигносульфонаты, желатин, аравийская камедь, фосфолипиды, крахмал, гидрофобный модифицированный крахмал и производные целлюлозы, в частности, сложный эфир целлюлозы и простой эфир целлюлозы, также поливиниловый спирт, поливинилацетат, поливинилпирролидон, полиакриловая кислота, полиметакриловая кислота и сополимеризаты (мет)акриловой кислоты и сложных эфиров (мет)акриловой кислоты, а также сополимеризаты метакриловой кислоты и сложных эфиров метакриловой кислоты, которые нейтрализованы гидроксидом щелочных металлов, а также продукты конденсации, при необходимости, замещенных солей нафталинсульфокислоты с формальдегидом. Наличие ПАВ необходимо, если один из активных ингредиентов и/или инертных носителей нерастворим в воде, и когда при применении необходимо растворение в воде. Пропорциональная часть ПАВ составляет 5 - 40 мас.% от массы композиции по изобретению.

Также возможно использование таких красителей, как неорганические пигменты, например, оксид железа, оксид титана и прусская синь, и органических

красителей, таких как ализариновые красители, азокрасители и металфталоцианиновые красители, и микроэлементов, таких как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

Антивспенивающие вещества, которые могут присутствовать в препаратах, включают, например, силиконовые эмульсии, длинноцепочечные спирты, жирные кислоты и их соли, а также фторорганические вещества и их смеси.

Примерами загустителей являются полисахариды, например, ксантановая камедь или вигум, например, аттапульгит, бентонит, а также тонкодисперсная двуокись кремния.

При необходимости, также возможно, чтобы присутствовали дополнительные компоненты, например, защитные коллоиды, связующие вещества, клеящие вещества, загустители, тиксотропные вещества, смачивающие вещества, стабилизаторы, секвестранты, комплексообразующие вещества. В целом, активные ингредиенты могут связываться с любой твердой или жидкой добавкой, которая соответствует обычным технологиям изготовления.

Активные ингредиенты по изобретению могут быть также использованы в отдельности или, в зависимости от определенных физических и/или химических свойств, в виде полученных из них препаратов или форм для применения, таких как аэрозоли, капсулированные суспензии, холодные аэрозольные концентраты, теплые аэрозольные концентраты, капсульные гранулы, мелкие гранулы, жидкотекучие концентраты для обработки семян, готовые растворы, пылевидные порошки, концентраты эмульсии, эмульсии типа «масло в воде», эмульсии типа «вода в масле», макрогранулы, микрогранулы, диспергируемые в масле порошки, смешиваемые с маслом жидкотекучие концентраты, смешиваемые с маслом жидкости, газ (под давлением), газогенерирующие вещества, пены, пасты, семена, покрытые пестицидами, концентраты суспензии, концентраты суспензии-эмульсии, растворимые концентраты, суспензии, впитывающие влагу порошки, растворимые порошки, пылевидные препараты и гранулы, растворимые в воде или диспергируемые в воде гранулы или таблетки, растворимые в воде или диспергируемые в воде порошки для обработки семян, впитывающие влагу порошки, натуральные продукты и синтетические вещества, пропитанные активным

ингредиентом, а также микрокапсуляции в полимерном веществе и в материалах покрытия для семян, а также холодные и теплые аэрозольные препараты для УМО.

Композиции по изобретению включают не только готовые для применения препаративные формы и могут наноситься с использованием соответствующего устройства на растения или семена, но также и коммерческие концентраты, которые должны разбавляться водой перед использованием. Обычными способами применения являются, например, разбавление в воде, и последующее распыление полученной жидкости для распыления, применение после разбавления в масле, непосредственное применение без разбавления, обработка семян или внесение гранул в почву.

Композиции и препаративные формы по изобретению обычно содержат 0,05 - 99 мас.%, 0,01 - 98 мас.%, предпочтительно 0,1 - 95 мас.%, более предпочтительно 0,5 - 90 мас.% активного ингредиента, наиболее предпочтительно 10 - 70 мас.%. Для определенных сфер применения, например, для защиты дерева и полученных из лесоматериалов продуктов композиции и препаративные формы по изобретению обычно содержат 0,0001 - 95 мас.%, предпочтительно 0,001 - 60 мас.% активного ингредиента.

Содержание активного ингредиента в формах для применения, полученных из коммерческих препаративных форм, может варьироваться в широком диапазоне. Концентрация активных ингредиентов в формах для применения может, как правило, составлять 0,000001 - 95 мас.%, предпочтительно 0,0001 - 2 мас.%.

Упомянутые препаративные формы могут быть получены известными способами, например, путем смешивания активных ингредиентов, по меньшей мере, с одним обычным наполнителем, растворителем или разбавителем, вспомогательным веществом, эмульгатором, дисперсантом и/или связывающим веществом или закрепляющим веществом, увлажняющим реагентом, водоотталкивающим средством, при необходимости, обезвоживающим веществом и УФ-стабилизаторами и, при необходимости, красителями, пигментами, антивспенивающими агентами, консервантами, неорганическими и органическими загустителями, клеящими веществами, гиббереллинами, технологическими вспомогательными веществами, а также водой. В зависимости от типа

изготавливаемой препаративной формы, могут быть необходимы дальнейшие этапы обработки, например, мокрый помол, сухой помол и гранулирование.

Активные ингредиенты по изобретению могут быть использованы по отдельности или в форме (промышленно доступных) препаративных форм или в формах, изготовленных из данных препаративных форм, как смесь с другими (известными) активными ингредиентами, такими как инсектициды, аттрактанты, стерилизующие средства, бактерициды, акарициды, нематоциды, фунгициды, регуляторы роста, гербициды, антидоты, удобрения и/или химические сигнальные вещества.

Обработка растений и их частей по изобретению активными ингредиентами или композициями производится непосредственно на растения или путем воздействия на окружающую среду, место произрастания или хранения общепринятыми способами обработки, например, путем погружения, распыления, мелкодисперсного разбрызгивания, орошения, выпаривания, мелкокапельного опрыскивания, рассеивания, разбросного внесения, внесения с пеной, нанесения покрытия, распределения на площади посева, полива (пропитки), капельного полива, а в случае материала для размножения, в частности, семян, также путем сухого протравливания семян, мокрого протравливания семян, полусухого протравливания, инкрустации семян, путем нанесения одного или нескольких слоев покрытия. Также можно вносить активные ингредиенты методом внесения ультра-малых объемов (УМО) или впрыскивать сам активный ингредиент в почву.

Смеси

Соединения формулы (I-S) могут быть использованы в отдельности или в композициях/препаративных формах и могут смешиваться с другими известными активными ингредиентами, например, фунгицидами, бактерицидами, акарицидами, нематоцидами или инсектицидами с целью расширить таким образом, например, спектр активности или предотвратить развитие устойчивости к таким соединениям у вредоносных организмов.

Применимые вещества для использования в смеси включают, например, известные фунгициды, инсектициды, акарициды, нематоциды, а также бактерициды (также см. Справочник пестицидов, 14-е издание).

Также возможны смеси с иными известными активными ингредиентами, такими как гербициды, или с удобрениями или регуляторами роста, антидотами и/или сигнальными химическими веществами.

Таким образом настоящее изобретение также относится к смесям и препаратам, содержащим по меньшей мере одно соединение формулы (I-S) и по меньшей мере одно дополнительное активное соединение, выбранное из группы фунгицидов, бактерицидов, акарицидов, нематоцидов, инсектицидов, гербицидов, удобрений, регуляторов роста, антидотов и/или химических сигнальных веществ, более предпочтительно из фунгицидов, инсектицидов, гербицидов, регуляторов роста и/или антидотов, наиболее предпочтительно из фунгицидов.

Предпочтительно, по меньшей мере, одно дополнительное активное соединение представляет собой фунгицид, выбранный из следующих групп

- (1) ингибиторы синтеза эргостерола,
- (2) ингибиторы дыхательной цепи в комплексе I или II,
- (3) ингибиторы дыхательной цепи в комплексе III,
- (4) ингибиторы митоза и деления клеток,
- (5) соединения, способные оказывать многонаправленное действие,
- (6) соединения, способные индуцировать иммунную защиту,
- (7) ингибиторы биосинтеза аминокислоты и/или белка,
- (8) ингибиторы продуцирования АТФ,
- (9) ингибиторы синтеза клеточной стенки,
- (10) ингибиторы синтеза липидов и мембранного синтеза,
- (11) ингибиторы биосинтеза меланина,
- (12) ингибиторы синтеза нуклеиновых кислот,
- (13) ингибиторы трансдукции сигнала,
- (14) соединения, способные выступать в качестве разобщающего агента,
- (15) другие фунгициды.

Более предпочтительно, по меньшей мере, одно дополнительное активное соединение выбрано из групп, состоящих из (1.001) ципроконазола, (1.002) дифеноконазола, (1.003) эпоксиконазола, (1.004) фенгексамида, (1.005) фенпропидина, (1.006) фенпропиморфа, (1.007) фенпиразамина, (1.008) флуквинконазола, (1.009) флутриафола, (1.010) имазалила, (1.011) имазалил сульфата, (1.012) ипконазола, (1.013) метконазола, (1.014) миклобутанила, (1.015) паклобутразола, (1.016) прохлораза, (1.017) пропиконазола, (1.018) протиоконазола, (1.019) Пиризоксазола, (1.020) спироксамина, (1.021) тебуконазола, (1.022) тетраконазола, (1.023) триадименола, (1.024) тридеморфа, (1.025) тритиконазола, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-хлорбензил)-2-(хлорметил)-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-илметил)циклопентанола, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-хлорбензил)-2-(хлорметил)-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-илметил)циклопентанола, (1.028) (2R)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1R)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ола, (1.029) (2R)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1S)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ола, (1.030) (2R)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола, (1.031) (2S)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1R)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ола, (1.032) (2S)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1S)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ола, (1.033) (2S)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола, (1.034) (R)-[3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,2-оксазол-4-ил](пиридин-3-ил)метанола, (1.035) (S)-[3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,2-оксазол-4-ил](пиридин-3-ил)метанола, (1.036) [3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,2-оксазол-4-ил](пиридин-3-ил)метанола, (1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-4-метил-1,3-диоксолан-2-ил}метил)-1H-1,2,4-триазола, (1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-4-метил-1,3-диоксолан-2-ил}метил)-1H-1,2,4-триазола, (1.039) 1-{[3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол-5-ил тиоцианата, (1.040) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол-5-ил тиоцианата, (1.041) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол-5-ил тиоцианата, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-

триазол-3-тиона, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.050) 2-[1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.051) 2-[2-хлор-4-(2,4-дихлорфенокси)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола, (1.052) 2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ола, (1.053) 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ола, (1.054) 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пентан-2-ола, (1.055) 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола, (1.056) 2-{[3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.057) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.058) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тиона, (1.059) 5-(4-хлорбензил)-2-(хлорметил)-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-илметил)циклопентанола, (1.060) 5-(аллилсульфанил)-1-{[3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазола, (1.061) 5-(аллилсульфанил)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазола, (1.062) 5-(аллилсульфанил)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазола, (1.063) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(1,1,2,2-тетрафторэтокси)фенил]сульфанил}фенил)-N-этил-N-метилимидоформамида, (1.064) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(2,2,2-трифторэтокси)фенил]сульфанил}фенил)-N-этил-N-метилимидоформамида, (1.065) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(2,2,3,3-тетрафторпропорокси)фенил]сульфанил}фенил)-N-этил-N-метилимидоформамида, (1.066) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(пентафторэтокси)фенил]сульфанил}фенил)-N-этил-N-метилимидоформамида, (1.067) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(1,1,2,2-тетрафторэтил)сульфанил]фенокси}фенил)-N-

этил-N-метилимидоформаида, (1.068) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(2,2,2-трифторэтил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.069) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(2,2,3,3-тетрафторпропил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.070) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(пентафторэтил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.071) N'-(2,5-диметил-4-феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.072) N'-(4-{[3-(дифторметокси)фенил]сульфанил}-2,5-диметилфенил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.073) N'-(4-{3-[(дифторметил)сульфанил]феноксифенил}-2,5-диметилфенил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.074) N'-[5-бром-6-(2,3-дигидро-1H-инден-2-илокси)-2-метилпиридин-3-ил]-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.075) N'-(4-{[4,5-дихлор-1,3-thiazol-2-ил]окси}-2,5-диметилфенил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.076) N'-(5-бром-6-[(1R)-1-(3,5-дифторфенил)этокси]-2-метилпиридин-3-ил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.077) N'-(5-бром-6-[(1S)-1-(3,5-дифторфенил)этокси]-2-метилпиридин-3-ил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.078) N'-(5-бром-6-[(цис-4-изопропилциклогексил)окси]-2-метилпиридин-3-ил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.079) N'-(5-бром-6-[(транс-4-изопропилциклогексил)окси]-2-метилпиридин-3-ил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.080) N'-(5-бром-6-[1-(3,5-дифторфенил)этокси]-2-метилпиридин-3-ил)-N-этил-N-метилимидоформаида, (1.081) Мефентрифлуконазола, (1.082) Ипфентрифлуконазола, (2.001) бензовиндифлупира, (2.002) биксафена, (2.003) боскалида, (2.004) карбоксина, (2.005) флуопирама, (2.006) флутоланила, (2.007) флуксапироксада, (2.008) фураметпира, (2.009) Изофетамида, (2.010) изопиразама (антиэпимерного энантиомера 1R,4S,9S), (2.011) изопиразама (антиэпимерного энантиомера 1S,4R,9R), (2.012) изопиразама (антиэпимерного рацемата 1RS,4SR,9SR), (2.013) изопиразама (смеси син-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9RS и антиэпимерного рацемата 1RS,4SR,9SR), (2.014) изопиразама (син-эпимерного энантиомера 1R,4S,9R), (2.015) изопиразама (син-эпимерного энантиомера 1S,4R,9S), (2.016) изопиразама (син-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9RS), (2.017) пенфлуфена, (2.018) пентиопирада, (2.019) пидифлуметофена, (2.020) Пиразифлумида, (2.021) седаксана, (2.022) 1,3-диметил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксаида, (2.023) 1,3-диметил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксаида, (2.024) 1,3-диметил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-

пиразол-4-карбоксамида, (2.025) 1-метил-3-(трифторметил)-N-[2'-(трифторметил)бифенил-2-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.026) 2-фтор-6-(трифторметил)-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)бензамида, (2.027) 3-(дифторметил)-1-метил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.028) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.029) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.030) 3-(дифторметил)-N-(7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.031) 3-(дифторметил)-N-[(3R)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.032) 3-(дифторметил)-N-[(3S)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.033) 5,8-дифтор-N-[2-(2-фтор-4-{[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси}фенил)этил]хиназолин-4-амин, (2.034) N-(2-циклопентил-5-фторбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.035) N-(2-трет-бутил-5-метилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.036) N-(2-трет-бутилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.037) N-(5-хлор-2-этилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.038) N-(5-хлор-2-изопропилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метаннафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метаннафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.041) N-[1-(2,4-дихлорфенил)-1-метоксипропан-2-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.042) N-[2-хлор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.043) N-[3-хлор-2-фтор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.044) N-[5-хлор-2-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.045) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-N-[5-метил-2-(трифторметил)бензил]-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.046) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-фтор-6-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.047) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропил-5-

метилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.048) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карботиоамида, (2.049) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.050) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(5-фтор-2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.051) N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-4,5-диметилбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.052) N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-фторбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.053) N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-метилбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.054) N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-фторбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.055) N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-метилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (2.056) N-циклопропил-N-(2-циклопропилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, (3.001) аметоктрадина, (3.002) амисульброма, (3.003) азоксистробина, (3.004) коуметоксистробина, (3.005) коумоксистробина, (3.006) циазофамида, (3.007) димоксистробина, (3.008) эноксастробина, (3.009) фамоксадона, (3.010) фенамидона, (3.011) флуфеноксистробина, (3.012) флуоксастробина, (3.013) крезоксим-метила, (3.014) метоминостробина, (3.015) оризастробина, (3.016) пикоксистробина, (3.017) пиракlostробина, (3.018) пираметостробина, (3.019) пираоксистробина, (3.020) трифлоксистробина, (3.021) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{[(E)-1-фтор-2-фенилвинил]окси}фенил)этилиден]амино}окси)метил]фенил}-2-(метоксиимино)-N-метилацетамида, (3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-хлорфенил)-1H-пиразол-3-ил]окси}-2-(метоксиимино)-N,3-диметилпент-3-енамида, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-диметилфенокси)метил]фенил}-2-метокси-N-метилацетамида, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-диметилфенокси)метил]фенил}-2-метокси-N-метилацетамида, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-бензил-3-[(3-{(изобутирилокси)метокси}-4-метоксипиридин-2-ил}карбонил)амино]-6-метил-4,9-диоксо-1,5-диоксонан-7-ил 2-метилпропаноата, (3.026) 2-{2-[(2,5-диметилфенокси)метил]фенил}-2-метокси-N-метилацетамида, (3.027) N-(3-этил-3,5,5-триметилциклогексил)-3-формамидо-2-гидроксибензамида, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-хлор-2-фторфенил)-1H-пиразол-3-ил]окси}-2-(метоксиимино)-N,3-диметилпент-3-енамида, (3.029) метил {5-[3-(2,4-диметилфенил)-1H-пиразол-1-ил]-2-метилбензил}карбамата, (4.001) карбендазима,

(4.002) диэтофенкарба, (4.003) этабоксама, (4.004) флуопиколида, (4.005) пенцикурона, (4.006) тиабендазола, (4.007) тиофанат-метила, (4.008) зоксамида, (4.009) 3-хлор-4-(2,6-дифторфенил)-6-метил-5-фенилпиридазина, (4.010) 3-хлор-5-(4-хлорфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-6-метилпиридазина, (4.011) 3-хлор-5-(6-хлорпиридин-3-ил)-6-метил-4-(2,4,6-трифторфенил)пиридазина, (4.012) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.013) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-бром-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.014) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-бромфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.015) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.016) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлорфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.017) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.018) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.019) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.020) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлорфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.021) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.022) 4-(4-хлорфенил)-5-(2,6-дифторфенил)-3,6-диметилпиридазин, (4.023) N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.024) N-(2-бромфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.025) N-(4-хлор-2,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (5.001) бордосской смеси, (5.002) каптафола, (5.003) каптана, (5.004) хлорталонила, (5.005) гидроксида меди, (5.006) нафтената меди, (5.007) оксида меди, (5.008) оксихлорида меди, (5.009) сульфата меди(2+), (5.010) дитианона, (5.011) додина, (5.012) фолпета, (5.013) манкоцеба, (5.014) манеба, (5.015) метирама, (5.016) метирама цинка, (5.017) оксината меди, (5.018) пропинеба, (5.019) серы и препаратов серы, включая полисульфид кальция, (5.020) тирама, (5.021) цинеба, (5.022) цирама, (5.023) 6-этил-5,7-диоксо-6,7-дигидро-5H-пирроло[3',4':5,6][1,4]дитиино[2,3-с][1,2]тиазол-3-карбонитрила, (6.001) ацибензолар-S-метила, (6.002) изотианила, (6.003) пробеназола, (6.004) тиадинила, (7.001) ципродинила, (7.002) касугамицина, (7.003) касугамицин гидрохлорид гидрата, (7.004) окситетрациклина, (7.005) пириметанила, (7.006) 3-(5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)хинолона, (8.001) силтиофама, (9.001) бентиаваликарба, (9.002) диметоморфа, (9.003) флуморфа, (9.004) ипроваликарба, (9.005) мандипропамида, (9.006) пириморфа, (9.007) валифеналата, (9.008) (2E)-3-(4-трет-бутилфенил)-3-(2-хлорпиридин-4-ил)-1-

(морфолин-4-ил)проп-2-ен-1-она, (9.009) (2Z)-3-(4-трет-бутилфенил)-3-(2-хлорпиридин-4-ил)-1-(морфолин-4-ил)проп-2-ен-1-она, (10.001) пропамокарба, (10.002) пропамокарб гидрохлорида, (10.003) толклофос-метила, (11.001) трициклазола, (11.002) 2,2,2-трифторэтил {3-метил-1-[(4-метилбензоил)амино]бутан-2-ил}карбамата, (12.001) беналаксила, (12.002) беналаксила-М (киралаксил), (12.003) металаксила, (12.004) металаксила-М (мефеноксама), (13.001) флудиоксонила, (13.002) ипродиона, (13.003) процимидона, (13.004) проквиназида, (13.005) хиноксифена, (13.006) винклозолина, (14.001) флуазинама, (14.002) мептилдинокап, (15.001) абсцизовая кислотаа, (15.002) бентиазола, (15.003) бетоксазина, (15.004) капсимицина, (15.005) карвона, (15.006) хинометионата, (15.007) куфранеба, (15.008) цифлуфенамида, (15.009) цимоксанила, (15.010) ципросульфамида, (15.011) флутанила, (15.012) фосетил-алюминия, (15.013) фосетил-кальция, (15.014) фосетил-натрия, (15.015) метил изотиоцианата, (15.016) метрафенона, (15.017) милдиомицина, (15.018) натамицина, (15.019) никель диметилдитиокарбамата, (15.020) нитротал-изопропила, (15.021) оксамокарба, (15.022) оксатиапипропила, (15.023) оксифентиина, (15.024) пентахлорфенола и солей, (15.025) фосфорной кислота и ее солей, (15.026) пропамокарб-фосетилата, (15.027) пирюфенона (хлазафенона), (15.028) тебуфлоквина, (15.029) теклофталама, (15.030) толнифанида, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил]-1,3-тиазол-2-ил}пиперидин-1-ил)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]этанона, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил]-1,3-тиазол-2-ил}пиперидин-1-ил)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]этанона, (15.033) 2-(6-бензилпиридин-2-ил)хиназолина, (15.034) 2,6-диметил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)-тетрона, (15.035) 2-[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]-1-[4-(4-{5-[2-(проп-2-ин-1-илокси)фенил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил}-1,3-тиазол-2-ил)пиперидин-1-ил]этанона, (15.036) 2-[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]-1-[4-(4-{5-[2-хлор-6-(проп-2-ин-1-илокси)фенил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил}-1,3-тиазол-2-ил)пиперидин-1-ил]этанона, (15.037) 2-[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]-1-[4-(4-{5-[2-фтор-6-(проп-2-ин-1-илокси)фенил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил}-1,3-тиазол-2-ил)пиперидин-1-ил]этанона, (15.038) 2-[6-(3-фтор-4-метоксифенил)-5-метилпиридин-2-ил]хиназолина, (15.039) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}-3-хлорфенил метансульфоната, (15.040) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-

бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}-3-хлорфенил метансульфоната, (15.041) 2-{2-[(7,8-дифтор-2-метилхинолин-3-ил)окси]-6-фторфенил}пропан-2-ола, (15.042) 2-{2-фтор-6-[(8-фтор-2-метилхинолин-3-ил)окси]фенил}пропан-2-ола, (15.043) 2-{3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}-3-хлорфенил метансульфоната, (15.044) 2-{3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}фенил метансульфоната, (15.045) 2-фенилфенола и солей, (15.046) 3-(4,4,5-трифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)хинолина, (15.047) 3-(4,4-дифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)хинолина, (15.048) 4-амино-5-фторпиримидин-2-ола (таутомерная форма: 4-амино-5-фторпиримидин-2(1Н)-он), (15.049) 4-оксо-4-[(2-фенилэтил)амино]бутановой кислоты, (15.050) 5-амино-1,3,4-тиадиазол-2-тиола, (15.051) 5-хлор-N'-фенил-N'-(проп-2-ин-1-ил)тиофен-2-сульфоногидразида, (15.052) 5-фтор-2-[(4-фторбензил)окси]пиримидин-4-амина, (15.053) 5-фтор-2-[(4-метилбензил)окси]пиримидин-4-амина, (15.054) 9-фтор-2,2-диметил-5-(хинолин-3-ил)-2,3-дигидро-1,4-бензоксазепина, (15.055) бут-3-ин-1-ил {6-[(1-(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)(фенил)метил)амино}окси)метил]пиридин-2-ил}карбамата, (15.056) этил (2Z)-3-амино-2-циано-3-фенилакрилата, (15.057) феназин-1-карбоновой кислоты, (15.058) пропил 3,4,5-тригидроксибензоата, (15.059) хинолин-8-ола, (15.060) хинолин-8-ол сульфата (2:1), (15.061) трет-бутил {6-[(1-(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)(фенил)метил)амино}окси)метил]пиридин-2-ил}карбамата и (15.062) 5-фтор-4-имино-3-метил-1-[(4-метилфенил)сульфонил]-3,4-дигидропиримидин-2(1Н)-она.

Защита растений/посевов

Активные ингредиенты или композиции по изобретению обладают сильным микробицидным действием и могут быть использованы для борьбы с нежелательными микроорганизмами, такими как грибы или бактерии, при защите растений и при защите материалов.

Настоящее изобретение также относится к способу борьбы с нежелательными микроорганизмами, при котором активные ингредиенты по изобретению наносят на фитопатогенные грибы, фитопатогенные бактерии и/или место их распространения.

Фунгициды могут быть использованы для защиты посевов и борьбы с фитопатогенными грибами. Они характеризуются превосходной эффективностью в отношении широкого спектра фитопатогенных грибов, включая передающиеся через почву патогены, в частности, из классов *Plasmodiophoromycetes*, *Peronosporomycetes* (син. *Oomycetes*), *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* и *Deuteromycetes* (син. *Fungi imperfecti*). Некоторые фунгициды являются системно активными и могут быть использованы для защиты растений, в качестве листовых фунгицидов, фунгицидов для протравливания семян или почвенных фунгицидов. Кроме того, они подходят для борьбы с грибами, которые, помимо прочего, появляются на деревьях или корнях растений.

Бактерициды могут быть использованы для защиты посевов для борьбы с *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* и *Streptomycetaceae*.

Примеры патогенов грибковых заболеваний, которые могут подвергаться обработке согласно изобретению, помимо прочего, включают:

заболевания, вызванные патогенами мучнистой росы, например, видами *Blumeria*, например, *Blumeria graminis*; видами *Podosphaera*, например, *Podosphaera leucotricha*; видами *Sphaerotheca*, например, *Sphaerotheca fuliginea*; видами *Uncinula*, например, *Uncinula necator*;

заболевания, вызванные возбудителями ржавчинных заболеваний, например, видами *Gymnosporangium*, например, *Gymnosporangium sabinae*; видами *Hemileia*, например, *Hemileia vastatrix*; видами *Phakopsora*, например, *Phakopsora pachyrhizi* и *Phakopsora meibomia*; видами *Puccinia*, например, *Puccinia recondite*, *P. trititica*, *P. graminis* или *P. striiformis*; видами *Uromyces*, например, *Uromyces appendiculatus*;

заболевания, вызванные патогенами из группы *Oomycetes*, например, видами *Albugo*, например, *Albugo candida*; видами *Bremia*, например, *Bremia lactucae*; видами *Peronospora*, например, *Peronospora pisi* или *P. brassicae*; видами *Phytophthora*, например, *Phytophthora infestans*; видами *Plasmopara*, например, *Plasmopara viticola*; видами *Pseudoperonospora*, например, *Pseudoperonospora humuli* или *Pseudoperonospora cubensis*; видами *Pythium*, например, *Pythium ultimum*;

заболевания пятнистости листьев и заболевания увядания листьев, вызванные, например, видами *Alternaria*, например, *Alternaria solani*; видами

Cercospora, например, *Cercospora beticola*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium cucumerinum*; видами *Cochliobolus*, например, *Cochliobolus sativus* (форма конидии: *Drechslera*, Син: *Helminthosporium*), *Cochliobolus miyabeanus*; видами *Colletotrichum*, например, *Colletotrichum lindemuthianum*; видами *Cycloconium*, например, *Cycloconium oleaginum*; видами *Diaporthe*, например, *Diaporthe citri*; видами *Elsinoe*, например, *Elsinoe fawcettii*; видами *Gloeosporium*, например, *Gloeosporium laeticolor*; видами *Glomerella*, например, *Glomerella cingulata*; видами *Guignardia*, например, *Guignardia bidwelli*; видами *Leptosphaeria*, например, *Leptosphaeria maculans*, *Leptosphaeria nodorum*; видами *Magnaporthe*, например, *Magnaporthe grisea*; видами *Microdochium*, например, *Microdochium nivale*; видами *Mycosphaerella*, например, *Mycosphaerella graminicola*, *M. arachidicola* и *M. fijiensis*; видами *Phaeosphaeria*, например, *Phaeosphaeria nodorum*; видами *Pyrenophora*, например, *Pyrenophora teres*, *Pyrenophora tritici repentis*; видами *Ramularia*, например, *Ramularia collo-cygni*, *Ramularia areola*; видами *Rhynchosporium*, например, *Rhynchosporium secalis*; видами *Septoria*, например, *Septoria apii*, *Septoria lycopersii*; видами *Typhula*, например, *Typhula incarnata*; видами *Venturia*, например, *Venturia inaequalis*;

заболевания корня и стебля, вызванные, например, видами *Corticium*, например, *Corticium graminearum*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium okcusprium*; видами *Gaeumannomyces*, например, *Gaeumannomyces graminis*; видами *Rhizoctonia*, такими как, например, *Rhizoctonia solani*; заболевания *Sarocladium*, вызванные, например, *Sarocladium oryzae*; заболевания *Sclerotium*, вызванные, например, *Sclerotium oryzae*; видами *Tapesia*, например, *Tapesia aciformis*; видами *Thielaviopsis*, например, *Thielaviopsis basicola*;

заболевания колоса и метелки (включая початки кукурузы), вызванные, например, *Alternaria* видами, например, *Alternaria* spp.; видами *Aspergillus*, например, *Aspergillus flavus*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium cladosporioides*; видами *Claviceps*, например, *Claviceps purpurea*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium culmorum*; видами *Gibberella*, например, *Gibberella zeae*; видами *Monographella*, например, *Monographella nivalis*; видами *Septoria*, например, *Septoria nodorum*;

заболевания, вызванные головневыми грибами, например, видами *Sphacelotheca*, например, *Sphacelotheca reiliana*; видами *Tilletia*, например, *Tilletia*

caries, *T. controversa*; видами *Urocystis*, например, *Urocystis occulta*; видами *Ustilago*, например, *Ustilago nuda*, *U. nuda tritici*;

заболевания гнили плодов, вызванные, например, видами *Aspergillus*, например, *Aspergillus flavus*; видами *Botrytis*, например, *Botrytis cinerea*; видами *Penicillium*, например, *Penicillium expansum* и *P. purpurogenum*; видами *Sclerotinia*, например, *Sclerotinia sclerotiorum*; видами *Verticillium*, например, *Verticillium alboatrum*;

заболевания гниения, плесени, увядания, гнили и выпревания, передающиеся через семена и почву, вызванные, например, видами *Alternaria*, вызванные, например, *Alternaria brassicicola*; видами *Aphanomyces*, вызванные, например, *Aphanomyces euteiches*; видами *Ascochyta*, вызванные, например, *Ascochyta lentis*; видами *Aspergillus*, вызванные, например, *Aspergillus flavus*; видами *Cladosporium*, вызванные, например, *Cladosporium herbarum*; видами *Cochliobolus*, вызванные, например, *Cochliobolus sativus*; (форма конидии: *Drechslera*, *Bipolaris* Син: *Helminthosporium*); видами *Colletotrichum*, вызванные, например, *Colletotrichum coccodes*; видами *Fusarium*, вызванные, например, *Fusarium culmorum*; видами *Gibberella*, вызванные, например, *Gibberella zeae*; видами *Macrophomina*, вызванные, например, *Macrophomina phaseolina*; видами *Monographella*, вызванные, например, *Monographella nivalis*; видами *Penicillium*, вызванные, например, *Penicillium expansum*; видами *Phoma*, вызванные, например, *Phoma lingam*; видами *Phomopsis*, вызванные, например, *Phomopsis sojae*; видами *Phytophthora*, вызванные, например, *Phytophthora cactorum*; видами *Pyrenophora*, вызванные, например, *Pyrenophora graminea*; видами *Pyricularia*, вызванные, например, *Pyricularia oryzae*; видами *Pythium*, вызванные, например, *Pythium ultimum*; видами *Rhizoctonia*, вызванные, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Rhizopus*, вызванные, например, *Rhizopus oryzae*; видами *Sclerotium*, вызванные, например, *Sclerotium rolfsii*; видами *Septoria*, вызванные, например, *Septoria nodorum*; видами *Typhula*, вызванные, например, *Typhula incarnata*; видами *Verticillium*, вызванные, например, *Verticillium dahliae*;

раки, галлы и ведьмина метла, вызванные, например, видами *Nectria*, например, *Nectria galligena*;

болезни увядания, вызываемые, например, видами *Monilinia*, например, *Monilinia laxa*;

болезни пузырчатости или курчавости листьев, вызванные, например, видами *Exobasidium*, например, *Exobasidium vexans*;

видами *Taphrina*, например, *Taphrina deformans*;

заболевания увядания лесных растений, вызванные, например, эской винограда, вызванной, например, *Phaemoniella clamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* и *Fomitiporia mediterranea*; эутипозом, вызванным, например, *Eutypa lata*; ганодермой, вызванной, например, *Ganoderma boninense*; ригидопорусом, вызванным, например, *Rigidoporus lignosus*;

болезни цветков и семян, вызываемые, например, видами *Botrytis*, например, *Botrytis cinerea*;

болезни клубней растения, вызываемые, например, видами *Rhizoctonia*, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Helminthosporium*, например, *Helminthosporium solani*;

кила, вызванная, например, видами *Plasmidiophora*, например, *Plasmidiophora brassicae*;

болезни, вызываемые бактериальными патогенами, например, видами *Xanthomonas*, например, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; видами *Pseudomonas*, например, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; видами *Erwinia*, например, *Erwinia amylovora*.

Предпочтительно соединения по изобретению могут быть использованы для борьбы со следующими заболеваниями сои:

Грибковые заболевания листьев, стеблей, стручков и семян, например, пятнистость листьев *Alternaria* (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), антракноз (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), ржавая пятнистость (*Septoria glycines*), церкоспороз (*Cercospora kikuchii*), пятнистость листьев, вызываемая грибами хоанефора (*Choanephora infundibulifera trispora* (син.)), пятнистость листьев, вызываемая грибами дактилиофора (*Dactuliophora glycines*), ложная мучнистая роса (*Peronospora manshurica*), увядание, вызываемое грибами рода дрекслера (*Drechslera glycini*), церкоспороз сои (*Cercospora sojae*), пятнистость листьев, вызываемая грибами лептосферулина (*Leptosphaerulina trifolii*), пятнистость листьев, вызываемая грибами филлостикта (*Phyllosticta sojaecola*), ожог бобов и

стеблей сои (*Phomopsis sojae*), настоящая мучнистая роса (*Microsphaera diffusa*), пятнистость листьев, вызываемая грибами рода пиренохета (*Pyrenochaeta glycines*), ризоктониоз (*Rhizoctonia solani*), ржавчина (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomia*), парша (*Sphaceloma glycines*), увядание листьев, вызываемое грибами рода стемфилиум (*Stemphylium botryosum*), коринеспорозная пятнистость мишеневидная пятнистость листьев (*Corynespora cassiicola*).

Грибковые заболевания корней и оснований стебля, например, черная корневая гниль (*Calonectria crotalariae*), угольная гниль (*Macrophomina phaseolina*), фузариоз или фузариозный вилт, корневая гниль и гниль стручка и корневой шейки (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), гниение корней, вызываемое видами миколептодискус (*Mycoloptodiscus terrestris*), неocosmospora (*Neocosmospora vasinfecta*), гниль бобов и стеблей (*Diaporthe phaseolorum*), стеблевый рак (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), фитофтороз (*Phytophthora megasperma*), бурая гниль стеблей сои (*Phialophora gregata*), грибная гниль (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), ризоктониоз, войлочная болезнь и выпревание (*Rhizoctonia solani*), склеротиниоз (*Sclerotinia sclerotiorum*), склероциальная южная гниль (*Sclerotinia rolfsii*), гниение корней, вызываемое видами тиелавиопсис (*Thielaviopsis basicola*).

Фунгицидные композиции по изобретению могут быть использованы для лечения или для защиты/профилактической защиты от фитопатогенных грибов. Таким образом, изобретение также относится к способам лечения и защиты для борьбы с фитопатогенными грибами путем применения активных ингредиентов или композиций по изобретению, которые наносят на семена, растение или части растения, плоды или на почву, в которой произрастают растения.

Хорошая переносимость растениями активных ингредиентов в концентрации, необходимой для борьбы с заболеваниями растений, позволяет обрабатывать надземные части растений, посадочный материал и семян, а также почву.

Согласно данному изобретению, все растения и их части могут подвергаться обработке. Под растениями подразумеваются все растения и популяции растений, например, желательные и нежелательные дикорастущие и культурные сорта и

разновидности растений (независимо от того, защищаются ли они или не защищаются селекционным правом). Культурные сорта и разновидности растений могут быть получены обычными методами разведения и оптимизации, в дополнение к которым могут быть также использованы один или несколько методов биотехнологии, например, использование двойных гаплоидов, слияние протопластов, случайный и направленный мутагенез, использование генетических маркеров, или методами генной инженерии и биоинженерии. Под частями растений следует понимать все надземные и подземные части и органы растений, например, побег, лист, цветок и корень, в качестве примера можно привести листья, иглы, стебли, стволы, цветы, плодовые тела, плоды и семенной материал, а также корни, клубни и корневища. К частям растений также относится собираемый урожай и материал для вегетативного и генеративного размножения, например, черенки, клубни, корневища, побеги и семена.

Активные ингредиенты по изобретению, когда они хорошо переносятся растениями, обладают благоприятной гомеотермной токсичностью и хорошо переносятся окружающей средой; они могут быть использованы для защиты и органов растений, для увеличения урожая, для повышения качества собранного материала. Предпочтительно они могут быть использованы в качестве композиций для защиты посевов. Они обладают активностью против обычно чувствительных и устойчивых видов и для всех или некоторых стадий развития.

Растения, которые могут быть обработаны в соответствии с настоящим изобретением включают следующие основные сельскохозяйственные культуры: кукуруза, соя, люцерна, хлопок, подсолнечник, семена масличных культур *Brassica*, например, *Brassica napus* (например, канола, рапс), *Brassica rapa*, *B. juncea* (например, горчица (полевая)) и *Brassica carinata*, *Arecaceae sp.* (например, масличная пальма, кокос), рис, пшеница, сахарная свекла, сахарный тростник, овес, рожь, ячмень, просо и сорго, тритикале, лен, орехи, виноград и различные фрукты и овощи из различных ботанических таксонов, например, *Rosaceae sp.* (например, семечковые, такие как яблоки и груши, а также некоторые косточковые, такие как абрикосы, вишни, миндаль, сливы и персики, а также ягодные культуры, такие как земляника, малина, красная и черная смородина и крыжовник), *Ribesioideae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.* (например, оливковое дерево), *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.* (например,

авокадо, корица, камфора), *Musaceae* sp. (например, банановые деревья и плантации), *Rubiaceae* sp. (например, кофе), *Theaceae* sp. (например, чай), *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (например, лимоны, апельсины, мандарины и грейпфрут); *Solanaceae* sp. (например, томаты, картофель, перец, стручковый перец, баклажаны, табак), *Liliaceae* sp., *Compositae* sp. (например, салат-латук, артишоки и цикорий – включая цикорий корневой, цикорий салатный или цикорий обыкновенный), *Umbelliferae* sp. (например, морковь, петрушка, сельдерей салатный и сельдерей корневой), *Cucurbitaceae* sp. (например, огурцы – включая колючий огурец, тыквы, арбузы, тыквы бутылочные и дыни), *Alliaceae* sp. (например, лук-порей и лук репчатый), *Cruciferae* sp. (например, капуста белокочанная, капуста краснокочанная, брокколи, капуста цветная, капуста брюссельская, пекинская капуста, кольраби, редька обыкновенная, хрен обыкновенный, кресс-салат и капуста китайская), *Leguminosae* sp. (например, арахис, горох, чечевица и бобы – например, фасоль обыкновенная и кормовые бобы), *Chenopodiaceae* sp. (например, листовая свекла, свекла кормовая, шпинат, столовая свекла), *Linaceae* sp. (например, конопля посевная), *Cannabaceae* sp. (например, конопля культурная), *Malvaceae* sp. (например, окра, какао), *Papaveraceae* (например, мак), *Asparagaceae* (например, аспарегус); полезные и декоративные растения для сада и леса включая дерновые культуры, газонную траву, злаковые травы и *Stevia rebaudiana*; и в каждом случае генетически модифицированные типы этих растений.

Регуляция роста растений

В некоторых случаях, соединения по изобретению, при определенной концентрации или дозировке, могут применяться в качестве гербицидов, антидотов, регуляторов роста или агентов, улучшающих характеристики растений, или в качестве микробицидов, например, фунгицидов, противогрибковых средств, бактерицидов, вирицидов (включая композиции против виридов) или в качестве композиций против микоплазмоподобных организмов (MLO) и риккетсииподобных организмов (RLO). При необходимости, они также могут быть использованы в качестве промежуточных соединений или прекурсоров для синтеза других активных ингредиентов.

Активные ингредиенты по изобретению начинают участвовать в метаболизме растений и, следовательно, также могут участвовать в качестве регуляторов роста.

Использование регуляторов роста может иметь различное воздействие на растения. Воздействие таких веществ в значительной степени зависит от времени применения относительно стадии развития растения, а также от количеств активного ингредиента, которым обрабатываются растения, или который вносится в среду произрастания растений, а также от вида обработки или внесения. В каждом случае, регуляторы роста должны обладать определенным целевым воздействием на сельскохозяйственные культуры.

Соединения-регуляторы роста растений могут быть использованы, например, для замедления вегетативного развития растений. Такое подавление развития представляет экономический интерес, например, для дерновых культур, так как таким образом возможно уменьшить частоту кошения травы в декоративных садах, парках и спортивных площадках, на обочине дорог, в аэропортах или на площадях с фруктовыми культурами. Также подавление развития важно для травянистых и древесных растений, выращиваемых на обочинах дорог, вблизи трубопроводов или воздушных линий или, в целом, в таких местах, где нежелателен бурный рост растений.

Также, большое значение имеет применение регуляторов роста для подавления продольного роста злаковых культур. Это снижает или полностью устраняет опасность полегания растений до урожая. В дополнение, при использовании регуляторов роста может происходить укрепление стеблей злаков, что также снижает риск полегания. При использовании регуляторов роста для укрепления и укорочения стеблей злаков обеспечивается возможность внесения больших объемов удобрений для увеличения урожая без опасности полегания.

Для многих сельскохозяйственных культур подавление вегетативного развития растений обеспечивает возможность посадки растений с большей плотностью, таким образом, на одинаковой площади можно получить больший урожай. Еще одним преимуществом меньших растений, полученных таким образом, является то, что таким образом проще культивировать растения и собирать урожай.

При подавлении вегетативного развития растений можно также добиться больших урожаев, так как в этом случае обеспечивается более эффективное потребление питательных веществ и ассимилятов для образования цветков и плодов, а не для роста вегетативных частей растений.

Зачастую регуляторы роста также могут быть использованы для стимулирования вегетативного развития. Это весьма целесообразно, когда при сборе урожая собираются вегетативные части растения. Однако при стимулировании вегетативного развития может также стимулироваться генеративное развитие, поскольку в этом случае происходит образование большего количества ассимилятов, что приводит к образованию большего количества плодов или к образованию плодов большего размера.

В некоторых случаях может быть достигнуто увеличение урожая путем контроля метаболизма растения без заметных изменений в вегетативном развитии. В дополнение, регуляторы роста могут быть использованы для изменения состава растений, что в свою очередь может привести к улучшению качества урожая. Например, можно добиться увеличения содержания сахара в сахарной свекле, сахарном тростнике, ананасах и цитрусовых или увеличения содержания белков в сое или злаковых. Также возможно, например, использовать регуляторы роста для подавления распада целевых компонентов, например, сахара в сахарной свекле или сахарном тростнике, до или после сбора урожая. Также возможно положительно влиять на производство или исключение вторичных растительных компонентов. Одним из примеров является стимуляция потока латекса каучуковых деревьев.

Регуляторы роста могут оказывать влияние на образование партенокарпических плодов. В дополнение, можно влиять на пол цветка. Также возможно получение стерильной пыльцы, что важно при селекции и получении гибридных семян.

Использованием регуляторов роста можно контролировать ветвеобразование у растений. С другой стороны, при нарушении апикального доминирования можно стимулировать развитие боковых побегов, что может быть желательным в особенности при культивировании декоративных растений, также в комбинации с подавлением роста. С другой стороны, также возможно подавлять рост боковых побегов. Такой эффект представляет особый интерес, например, при выращивании табака или томатов.

Под воздействием регуляторов роста можно регулировать количество листьев на растениях, так, чтобы в необходимое время происходила дефолиация. Такая дефолиация играет важную роль при механическом сборе урожая хлопка, но

также и при сборе урожая других культур, например, при возделывании винограда. Дефолиация растений также может осуществляться для снижения транспирации у растений перед пересадкой.

Также регуляторы роста могут быть использованы для регулирования вскрытия плода. С другой стороны, таким образом можно предотвращать преждевременное вскрытие плода. С другой стороны, также можно стимулировать вскрытие плода или даже недоразвитие цветка для достижения необходимой массы («прореживание завязей») для устранения периодичности плодоношения. Под периодичностью плодоношения подразумевается свойство некоторых видов растений давать значительно отличающиеся объемы урожая от года к году по внутренне обусловленным причинам. Наконец, регуляторы роста могут быть использованы для того, чтобы во время сбора урожая плоды отделялись от растения с применением меньшей физической силы для обеспечения возможности механической уборки урожая или для облегчения ручной уборки.

Регуляторы роста могут быть также использованы для получения более раннего или наоборот, более позднего созревания собираемого материала до или после урожая. Это является особенно важным, так как это позволяет наилучшим образом подстраиваться под требования рынка. Кроме того, в некоторых случаях регуляторы роста могут улучшать цвет плодов. В дополнение, регуляторы роста могут быть также использованы для того, чтобы созревание происходило в течение определенного периода времени. Таким образом, создаются необходимые условия для того, чтобы обеспечить возможность механической или ручной уборки урожая в один этап, например, в случае табака, томатов или кофе.

В дополнение, с использованием регуляторов роста растений можно влиять на период покоя семян или почек растений так, чтобы, например, прорастание, побегообразование, цветение растений, таких как ананас или декоративные растения в питомниках, происходило в такие периоды, когда это не является обычным. В районах, где высока вероятность заморозков, с помощью регуляторов роста желательно обеспечить задержку в распускании почек или прорастании семян для того, чтобы избежать ущерба вследствие поздних заморозков.

Наконец, регуляторы роста могут придать растениям устойчивость к низким температурам, засухе или засоленности почвы. Этим обеспечивается возможность культивирования растений в районах непригодных, как правило, для таких целей.

Придание устойчивости / Жизнестойкость растений и другие эффекты

Активные соединения по изобретению также проявляют сильное укрепляющее воздействие на растения. Соответственно, они могут быть использованы для мобилизации защитной системы растения против атаки вредных микроорганизмов.

Под веществами, повышающими жизнестойкость растений (придающими растениям устойчивость), в контексте настоящего изобретения подразумеваются вещества, способные стимулировать защитную систему растения таким образом, чтобы обработанные растения впоследствии, при инокулировании их вредоносными микроорганизмами развивали бы высокую степень устойчивости к этим микроорганизмам.

Активные соединения по изобретению также способны повышать урожайность сельскохозяйственных культур. В дополнение, они демонстрируют пониженную токсичность и хорошо переносятся растениями.

Также, в контексте настоящего изобретения физиологические характеристики растения включают следующее:

устойчивость к абиотическому стрессу, что включает устойчивость к неблагоприятным температурным условиям, устойчивость к засухе и способность восстанавливаться после стрессовых засушливых условий, эффективность использования воды (что взаимосвязано со сниженным водопотреблением), устойчивость к затоплению, озоновый стресс и устойчивость к ультрафиолетовому излучению, устойчивость к химическим веществам, таким как тяжелые металлы, соли, пестициды (антидоты) и т.д.

Устойчивость к абиотическому стрессу, что включает повышенную устойчивость к грибам и повышенную устойчивость к нематодам, вирусам и бактериям. В контексте настоящего изобретения устойчивость к абиотическому стрессу предпочтительно включает повышенную устойчивость к грибам и повышенную устойчивость к нематодам.

Повышенную мощность растений, включая повышенную жизнестойкость растений / повышенное качество растений и повышенную энергию прорастания семян, сниженную склонность к полеганию, улучшенный внешний вид, улучшенную способность использовать питательные элементы, улучшенную способность к приобретению зеленой окраски и улучшенный коэффициент полезного действия фотосинтеза.

Воздействие на гормоны растения и/или функциональные ферменты.

Регулирующие воздействия на рост включают более раннее прорастание, улучшенную всхожесть, более развитую корневую систему и/или улучшенный рост корней, улучшенную способность побегообразования, более продуктивные побеги, более раннее цветение, увеличенную высоту и/или биомассу растения, укороченные стебли, улучшенный рост побегов, количество зерен на колос, количество колосьев на м², количество столонов и/или количество цветков, улучшенный индекс урожайности, больший размер листьев, меньшее количество мертвых базальных листьев, улучшенное листорасположение, более раннее вызревание/более раннее плодоношение, однородное вызревание, повышенная продолжительность периода налива зерна, улучшенное вызревание плодов, увеличенный размер плодов/овощей, устойчивость при прорастании и сниженное полегание.

Повышенную урожайность, в отношении общей биомассы на гектар, выхода в расчете на гектар, отношения веса косточки/фрукта, размера семени и/или веса гектолитра, а также в отношении улучшенного качества продукции, включая следующие характеристики:

улучшенная пригодность для переработки в отношении распределения по размерам (зерен, плодов и т.д.), однородное вызревание, влагосодержание зерна, улучшенные характеристики при помоле, улучшенные характеристики при винификации, улучшенные характеристики при варении пива, повышенный выход сока, улучшенные характеристики при сборе урожая, перевариваемость, число седиментации, число падения, стабильность стручков, стабильность при хранении, улучшенная длина/прочность/однородность волокон, повышенное качество молока и/или мяса у животных, кормление которых происходит с использованием силоса, адаптация при кулинарном приготовлении и жарке;

также включая улучшенные товарные качества в отношении улучшенного качества плодов/зерна, распределение по размерам (зерен, плодов и т.д.), большая продолжительность срока хранения/срока сохраняемости, твердость/мягкость, вкус (запах, консистенция и т.д.), сортность (размер, форма, количество ягод и т.д.), количество ягод/плодов на грозди, хрусткость, свежесть, покрытие воском, частота физиологических нарушений, цвет и т.д.;

также включая повышенное содержание целевых ингредиентов, например, содержание белков, жирных кислот, содержание масел, качество масел, аминокислотный состав, содержание сахаров, содержание кислот (pH), отношение сахара/кислоты (Brix), полифенолы, содержание крахмала, пищевая ценность, содержание глютена/клейковинность, энергосодержание, вкусовые качества и т.д.;

также включая пониженное содержание нежелательных ингредиентов, например, меньшее содержание микотоксинов, меньшее содержание афлатоксинов, уровень геосмина, содержание ароматических и фенольных компонентов, лакказы, полифенол оксидазы и пероксидазы, содержание нитратов и т.д.

Ресурсосберегающее земледелие, включая эффективность использования питательных веществ, в частности, эффективность использования азота (N), эффективность использования фосфора (P), эффективность использования воды, улучшенная транспирация, интенсивность дыхания и/или ассимиляции CO₂, улучшенное образование клубеньков, улучшенный Ca-метаболизм и т.д.

Замедленное старение, включая улучшение физиологии растения, которое выражается, например, в более продолжительном периоде налива зерна, что приводит к большей урожайности, увеличенная продолжительность периода с зелеными листьями, таким образом, включая окраску (появление зеленой окраски), содержание воды, степень сухости и т.д. Соответственно, в контексте настоящего изобретения было обнаружено, что в соответствии с определенным применением по изобретению комбинации активного соединения обеспечивается возможность увеличить продолжительность периода с зелеными листьями, в результате чего достижение полного развития (старение) растения происходит позже. Основным преимуществом для фермера является большая продолжительность периода налива зерна, что приводит к большей урожайности. Также, преимуществом для фермера является большая вариативность в отношении периода сбора урожая.

В настоящем документе термин «число седиментации» означает показатель качества белка по методу Зелени (значение Зелени) и описывает степень седиментации муки, суспендированной в растворе молочной кислоты, за стандартный интервал времени. Это является показателем хлебопекарного качества. Набухание фракции клейковины в муке в растворе молочной кислоты влияет на скорость седиментации в суспензии муки. Более высокое содержание и улучшенное качество клейковины обуславливают более низкую скорость седиментации и более высокие значения при тестировании по методу Зелени. Число седиментации муки зависит от состава белков в пшенице, наиболее тесно он взаимосвязан с содержанием белков, твердостью пшеницы и объемом хлеба в поддоне и жаровне. Более тесная взаимосвязь между объемом хлеба и объемом седиментации по Зелени по сравнению с объемом при SDS-седиментации может быть обусловлена тем, что содержание белков влияет как на объем, так и на показатель Зелени (*Czech J. Food Sci. том 21, No. 3: 91–96, 2000*).

Также термин «число падения» в настоящем документе относится к показателю хлебопекарного качества зерновых, в частности, пшеницы. С помощью теста для определения числа падения определяется, было ли повреждено зерно в результате прорастания. Это означает, что в зерне пшеницы произошло изменение физических свойств крахмала. В ходе этого теста производится анализ вязкости с помощью прибора для измерения числа падения путем измерения сопротивления водно-мучной суспензии падающему плунжеру. Время (в секундах) от начала анализа до падения плунжера известно как «число падения». Результаты теста определения числа падения регистрируются как показатель ферментной активности в образце пшеницы или муки; они выражаются как время в секундах. Высокое число падения (например, свыше 300 сек.) указывает на минимальную ферментную активность и хорошее качество пшеницы или муки. Низкое число падения (например, менее 250 сек.) указывает на значительную ферментную активность и то, что пшеница или мука повреждены в результате прорастания.

Термин «более развитая корневая система» / «улучшенный корневой рост» означает большую длину корневой системы, рост корня на большую глубину, большую скорость роста корня, большую массу корня в сухом состоянии / в сыром виде, больший объем корня, большую площадь поверхности корней, больший диаметр корня, большую прочность корня, большее ветвление корней, большее

количество корневых волосков и/или большее количество корневых кончиков; этот показатель может быть измерен путем анализа конфигурации корней с использованием соответствующих методов и программ для анализа изображения (например, WinRhizo).

Термин «эффективность использования воды культурой» означает в техническом отношении массу выхода сельскохозяйственной продукции на единицу потребляемой воды, а в экономическом отношении – стоимость произведенной продукции на единицу объема потребляемой воды; этот показатель может быть измерен, например, по следующим критериям: выход продукции на гектар, биомасса растений, масса тысячи зерен и количество колосьев на м².

Термин «эффективность использования азота» означает в техническом отношении массу выхода сельскохозяйственной продукции на единицу потребляемого азота, а в экономическом отношении – стоимость произведенной продукции на единицу объема потребляемого азота, что отражает потребление и эффективность использования.

Улучшенная способность к приобретению зеленой окраски/улучшенная окраска и улучшенная эффективность фотосинтеза, а также замедленное старение могут определяться известными методами, например, с помощью системы HandyPea (Hansatech). F_v/F_m – это параметр, широко используемый для определения максимального квантового выхода фотосистемы II (ФСII). Этот параметр является общепринятым параметром селективного определения эффективности фотосинтеза в растениях, при этом максимальное значение F_v/F_m здоровых образцов, как правило, достигает приблизительно 0,85. Более низкие значения наблюдаются, если образец подвергался каким-либо видам факторов биотического или абиотического стресса, в результате чего способность фотохимического тушения энергии в ФСII снизилась. F_v/F_m представляется как отношение переменной флуоресценции (F_v) к максимальному значению флуоресценции (F_m). В основном, индекс эффективности представляет собой показатель жизнеспособности образца. (Смотрите, например, *Advanced Techniques in Soil Microbiology*, 2007, 11, 319-341; *Applied Soil Ecology*, 2000, 15, 169-182.)

Улучшенная способность к приобретению зеленой окраски / улучшенная окраска и улучшенная эффективность фотосинтеза, а также замедленное старение

могут также оцениваться путем измерения чистой интенсивности фотосинтеза (P_n), измерения содержания хлорофиллов, например, путем метода определения пигментного состава экстракции по Циглеру и Эгле, измерения фотохимической эффективности (отношение F_v/F_m), определения интенсивности побегообразования и конечной биомассы корней и/или кроны, определение плотности побегов, а также интенсивности отмирания корней.

В контексте настоящего изобретения предпочтительным является улучшение характеристик физиологии растений, которые выбраны из группы, включающей следующие характеристики: улучшенный корневой рост/более развитая корневая система, улучшенная способность к приобретению зеленой окраски, улучшенная эффективность использования воды (что взаимосвязано со сниженным водопотреблением), улучшенная эффективность использования питательных веществ, включая, в частности, улучшенную эффективность использования азота (N), замедленное старение и увеличение урожайности.

В рамках увеличения урожайности предпочтительными являются следующие характеристики: улучшенное число седиментации и число падения, а также улучшенное содержание белков и сахаров, в частности, для растений, выбранных из группы злаковых культур (предпочтительно пшеницы).

Предпочтительно новое применение фунгицидных композиций по настоящему изобретению относится к комбинированному применению а) в профилактических и/или лечебных целях для борьбы с патогенными грибами и/или нематодами, с контролем устойчивости или без него, и b) по меньшей мере к одной из следующих характеристик: улучшенный корневой рост, улучшенная способность к приобретению зеленой окраски, улучшенная эффективность использования воды, замедленное старение и увеличение урожайности. Из группы b), в частности, особенно предпочтительными характеристиками являются b) улучшенный рост корневой системы, эффективность использования воды и азота.

Обработка семян

Настоящее изобретение также включает способ обработки семян.

Настоящее изобретение также относится к семенам, которые обработаны в соответствии с одним из способов, описанных в предыдущем параграфе. Семена по изобретению используются в способах защиты семян от вредоносных

микроорганизмов. В соответствии с этими способами используется семена, обработанные по меньшей мере одним активным ингредиентом по изобретению.

Активные ингредиенты или композиции по изобретению также пригодны для обработки семян. Большая часть повреждений сельскохозяйственных культур вредоносными организмами вызвана заражением семян во время хранения или после засева в почву, а также во время или после прорастания растений. Данная фаза особенно критична, так как в этот период корни и побеги растущего растения наиболее подвержены повреждениям, и даже небольшое повреждение может вызвать гибель растения. Поэтому особенно важна защита семян и прорастающих растений подходящими композициями.

Способы борьбы с фитопатогенными грибами путем обработки семян растений давно известны и постоянно совершенствуются. Однако обработка семян вызывает различные проблемы, которые не всегда могут быть решены удовлетворительно. Например, желательно разработать способы защиты семян и прорастающих растений, благодаря которым можно обойтись без дополнительного внесения композиций для защиты посевов после посадки растений или после появления всходов или, по меньшей мере, значительно снизить количество вносимых композиций. Также, желательно оптимизировать количество используемого активного ингредиента таким образом, чтобы обеспечить по возможности наиболее эффективную защиту семян и прорастающих растений от атаки фитопатогенных грибов, но без повреждения самого растения используемым активным ингредиентом. Чтобы способы обработки достигли оптимальной защиты семян и прорастающих растений с минимальным расходом защитных композиций, в частности, необходимо принимать во внимание естественные фунгицидные свойства трансгенных растений.

Таким образом, настоящее изобретение также относится к способу защиты семян и прорастающих растений от атаки фитопатогенных грибов путем обработки семян композицией по изобретению. Настоящее изобретение также относится к применению композиций по изобретению для обработки семян для защиты семян и прорастающих растений от фитопатогенных грибов. Изобретение также относится к семенам, которые обрабатывались композицией по изобретению для защиты от фитопатогенных грибов.

Борьба с фитопатогенными грибами, которые повреждают растения, после появления всходов осуществляют, в основном, путем обработки почвы и надземных частей растений композициями для защиты посевов. Из-за проблем, которые могут возникнуть вследствие возможного негативного воздействия композиций для защиты посевов на окружающую среду и здоровье людей и животных, прилагаются усилия для снижения используемых количеств активных ингредиентов.

Одним из преимуществ настоящего изобретения является то, что определенные системные характеристики активных ингредиентов и композиций по изобретению подразумевают то, что обработка семян такими активными ингредиентами и композициями обеспечивает защиту от фитопатогенных грибов не только самих семян, но и выросших из них растений после появления всходов. В данном случае прямую обработку культуры во время засева и сразу после него можно пропустить.

Также, предпочтительным считается то, что активные ингредиенты или композиции по изобретению, в частности, могут быть использованы для обработки трансгенных семян, в этом случае растение, выросшее из такого семени, способно экспрессировать белок, противодействующий вредителям. Путем обработки таких семян активными ингредиентами по изобретению, борьба с определенными вредителями может осуществляться исключительно путем экспрессии белка, например, инсектицидного белка. Неожиданно было обнаружено, что в этом случае может наблюдаться дополнительный синергический эффект, в результате которого эффективность защиты от атаки вредителей дополнительно возрастает.

Композиции по изобретению могут быть использованы для защиты семян любого сорта растения, используемого в сельском хозяйстве, при выращивании в теплице, в лесу или используемого в области растениеводства и виноградарства. В частности, это могут быть семена злаковых культур (таких как пшеница, ячмень, рожь, тритикале, сорго/просо и овес), кукуруза, хлопок, соя, рис, картофель, подсолнечник, бобы, кофе, свекла (например, сахарная свекла и кормовая свекла), арахис, масличный рапс, мак, оливы, кокос, какао, сахарный тростник, табак, овощи (такие как томаты, огурцы, лук и салат-латук), дерновые и декоративные культуры (см. также ниже). Особенное значение имеет обработка семян злаковых культур (таких как пшеница, ячмень, рожь, тритикале и овес), кукурузы и риса.

Как уже было отмечено, обработка трансгенных семян активными ингредиентами или композициями по изобретению представляет особую важность. Это относится к семенам растений, которые содержат как минимум один гетерологический ген. Определение и примеры соответствующих гетерологических генов приведены ниже.

В контексте настоящего изобретения семена обрабатываются композицией по изобретению в отдельности или в виде соответствующего препарата. Предпочтительно, чтобы семена были достаточно твердыми, чтобы не допустить повреждений во время обработки. Обычно обработка семян производится в любое время между сбором урожая и посевом. Обычно используются семена, которые были отделены от растения и у которых были удалены стержни початка, шелуха, плодоножки, оболочки, волоски или мякоть плода. Например, можно использовать семена, которые были собраны, очищены и высушены так, чтобы содержание влаги составляло менее 15 мас.%. В качестве альтернативы, также можно использовать семена, которые после высушивания, например, были обработаны водой, а затем снова высушены.

Во время обработки семян следует обращать особое внимание, чтобы количество композиции по изобретению, наносимое на семена, и/или количество дополнительных добавок подбирались таким образом, чтобы не навредить процессу прорастания семян и самому растению. Это следует помнить, в особенности, в случае использования активных ингредиентов, которые могут иметь фитотоксичное воздействие при определенных дозировках.

Композиции по изобретению могут применяться непосредственно, т.е. когда они не содержат каких-либо других компонентов, без разбавления. В целом, предпочтительно наносить композиции на семена в виде необходимого состава. Специалистам известны подходящие составы и способы обработки семян, которые также описаны, например, в следующих документах: US 4,272,417, US 4,245,432, US 4,808,430, US 5,876,739, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675, WO 2002/028186.

Из активных ингредиентов, применимых по настоящему изобретению, могут быть получены обычные препаративные формы для протравливания семян, такие как растворы, эмульсии, суспензии, порошки, пенные препаративные формы,

жидкие растворы или другие композиции для нанесения покрытия на семена, а также препаративные формы для УМО.

Эти препаративные формы получают обычными способами, путем смешивания активных ингредиентов с обычными добавками, например, обычными наполнителями, а также растворителями или разбавителями, красителями, смачивающими агентами, дисперсантами, эмульгаторами, антивспенивающими веществами, консервантами, вспомогательными загустителями, связывающими веществами, гиббереллинами, а также водой.

Применимыми красителями, которые могут присутствовать в препаративных формах для нанесения на семена, применимых согласно данному изобретению, являются любые красители, которые обычно могут быть использованы для таких целей. Также можно использовать другие пигменты, которые являются умеренно растворимыми в воде, или красители, которые являются растворимыми в воде. Примеры красителей включают красители, известные под наименованиями Родамин В, С.I. пигмент красный 112 и С.I. растворитель красный 1.

Применимыми смачивающими агентами, которые могут присутствовать в препаративных формах для нанесения на семена, применимых согласно данному изобретению, являются любые вещества, способствующие смачиванию, и которые обычно могут быть использованы при изготовлении препаративных форм, содержащих активные агрохимические ингредиенты. Предпочтительно используют алкилнафталин-сульфонаты, например, диизопропил- или диизобутилнафталин-сульфонаты.

Применимыми дисперсантами или эмульгаторами, которые могут присутствовать в препаративных формах для нанесения на семена, которые могут быть использованы согласно данному изобретению, являются любые неионные, анионные и катионные дисперсанты, которые обычно могут применяться при изготовлении препаративных форм, содержащих активные агрохимические ингредиенты. Предпочтительным является использование неионных или анионных дисперсантов или смесей неионных или анионных дисперсантов. Применимые неионные дисперсанты включают, в частности, блок-сополимеры этиленоксида и пропиленоксида, алкилфенол-полигликолевый эфир и тристририлилфенол-полигликолевый эфир, а также их фосфатированные и сульфатированные

производные. Применимыми анионными дисперсантами являются, в частности, лигносульфаты, соли полиакриловой кислоты и конденсаты формальдегида с арилсульфонатом.

Противовспенивающими веществами, которые могут присутствовать в препаративных формах для нанесения на семена, применимых согласно данному изобретению, являются любые пеноингибиторы, которые обычно могут быть использованы при изготовлении препаративных форм, содержащих активные агрохимические ингредиенты. Предпочтительными являются силиконовые противовспенивающие вещества и стеарат магния.

Консервантами, которые могут присутствовать в препаративных формах для нанесения на семена, применимых согласно данному изобретению, являются любые вещества, которые обычно могут быть использованы для таких целей при изготовлении агрохимических композиций. Примеры таких веществ включают дихлорфен и полуформаль бензилового спирта.

Вспомогательными загустителями, которые могут присутствовать в препаративных формах для нанесения на семена, применимых согласно данному изобретению, являются любые вещества, которые обычно могут быть использованы для таких целей при изготовлении агрохимических композиций. Предпочтительные примеры включают производные целлюлозы, производные акриловой кислоты, ксантан, модифицированные глины и мелкодисперсный оксид кремния.

Связывающими веществами, которые могут присутствовать в препаративных формах для нанесения на семена, применимых согласно данному изобретению, являются любые вещества, которые обычно могут быть использованы для таких целей при изготовлении продуктов для нанесения на семена. К предпочтительным примерам таких веществ относятся поливинилпирролидон, поливинилацетат, поливиниловый спирт и тилоза.

Гиббереллинами, которые могут присутствовать в препаративных формах для нанесения на семена, применимых согласно данному изобретению, могут предпочтительно являться гиббереллины A1, A3 (= гибберелловая кислота), A4 и A7; особенно предпочтительным является использование гибберелловой кислоты. Гиббереллины известны из уровня техники: (ср. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz-

und Schädlingsbekämpfungsmittel” [Chemistry of the Crop Protection Compositions and Pesticides], том 2, Springer Verlag, 1970, стр. 401-412).

Препаративные формы для протравливания семян, которые могут быть использованы в соответствии с настоящим изобретением, могут применяться непосредственно или после предварительного разбавления водой, для обработки широкого спектра различных семян, включая семена трансгенных растений. В этом случае, могут также возникать дополнительные синергические эффекты при взаимодействии с веществами, которые образуются в результате экспрессии.

Для обработки семян составами для протравливания семян, которые могут быть использованы в соответствии с настоящим изобретением, или полученными из них препаратами путем добавления воды, могут применяться все смесительные устройства, обычно применяющиеся для протравливания семян. В частности, при процедуре протравливания семян семена помещаются в смесительное устройство, к ним добавляют определенное, необходимое количество препаратов для протравливания семян, в отдельности или после разбавления водой, и производится перемешивание всего объема до однородного распределения препарата на семенах. При необходимости, за этим следует процесс высушивания.

Микотоксины

В дополнение, в результате обработки по изобретению может быть снижено содержание микотоксинов в собранном материале и в полученных из него пищевых продуктах и кормах. В частности, микотоксины включают, помимо прочего, следующие вещества: дезоксиниваленол (DON), ниваленол, 15-Ас-DON, 3-Ас-DON, Т2- и НТ2-токсин, фумонизины, зеараленон, монилиформин, фузарин, диацетооксисцирпенол (DAS), боверицин, энниатин, фузаропротрофериин, фузаренол, ократоксин, патулин, алкалоиды спорыньи и афлатоксины, которые могут производиться, например, следующими грибами: видами *Fusarium*, такими как *F. acuminatum*, *F. asiaticum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikuroi*, *F. musarum*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. poae*, *F. pseudograminearum*, *F. sambucinum*, *F. scirpi*, *F. semitectum*, *F. solani*, *F. sporotrichoides*, *F. langsethiae*, *F. subglutinans*, *F. tricinctum*, *F. verticillioides* и т.д., а также видами *Aspergillus*, такими как *A. flavus*, *A. parasiticus*, *A. nomius*, *A. ochraceus*, *A. clavatus*, *A. terreus*, *A. versicolor*, видами *Penicillium*, такими как *P. verrucosum*, *P.*

viridicatum, *P. citrinum*, *P. expansum*, *P. claviforme*, *P. roqueforti*, видами *Claviceps*, такими как *C. purpurea*, *C. fusiformis*, *C. paspali*, *C. africana*, видами *Stachybotrys* и другими.

Защита материалов

Активные ингредиенты или композиции/препаративные формы по изобретению могут быть также использованы для защиты материалов, для защиты промышленных материалов от поражения и разрушения вредоносными микроорганизмами, например, грибами и насекомыми.

В дополнение, соединения по изобретению могут быть использованы в качестве композиций, предохраняющих от биологического обрастания, в отдельности или комбинации с другими активными ингредиентами.

В контексте настоящего изобретения под термином «промышленные материалы» подразумеваются неживые материалы, которые предназначены для применения в промышленности. Промышленными материалами, защита которых может осуществляться с использованием активных ингредиентов по изобретению от изменений или разрушения вследствие воздействия микроорганизмов, могут являться, например, клеящие вещества, клеи, бумага, обои и доски/картон, текстильные материалы, ковры, кожа, древесина, волокнистая масса и ткани, краска и изделия из пластика, смазывающе-охлаждающие жидкости, и другие материалы, которые могут поражаться или разрушаться микроорганизмами. Также в составе материалов, защита которых может осуществляться по изобретению, можно упомянуть части производственных установок и зданий, например, контуры циркуляции охлаждающей воды, системы охлаждения и нагрева, а также блоки вентиляции и кондиционирования воздуха, которые могут разрушаться вследствие развития микроорганизмов. Промышленные материалы по настоящему изобретению предпочтительно включают клеящие вещества, грунтовки, бумагу и картон, кожу, древесину, краску, смазывающе-охлаждающие жидкости и теплообменные жидкости, более предпочтительно, древесину.

Активные ингредиенты или композиции по изобретению могут предотвращать негативные воздействия, такие как гниение, порча, изменение цвета, обесцвечивание или образование плесени.

В случае обработки дерева соединения/композиции по изобретению могут также быть использованы против грибковых заболеваний, которые могут развиваться на поверхности или внутри лесоматериалов. Термин «лесоматериалы» означает все виды пород дерева и все виды обработанной древесины, предназначенные для строительства, например, цельная древесина, древесина высокой плотности, ламинированная древесина и фанера. Способ обработки лесоматериалов по изобретению, в основном, состоит в контакте с одним или более соединениями по изобретению или композицией по изобретению; это включает, например, непосредственное нанесение, распыление, протравливание методом погружения, инъекции или любые другие соответствующие способы.

В дополнение, соединения по изобретению могут быть использованы для защиты от биологического обрастания объектов, которые контактируют с минерализованной или соленой водой, в частности, корпуса судов, экраны, сети, строения, мест стоянки и сигнальных систем.

Способ по изобретению для борьбы с вредоносными грибами может также использоваться для защиты продукции при хранении. Термин «складированная продукция» означает природные вещества растительного или животного происхождения и полученные путем их переработки продукты, природного происхождения, для которых необходима долгосрочная защита. Товары для хранения растительного происхождения включают, например, растения или их части, такие как стебли, листья, клубни, семена, плоды или зерно, могут быть защищены в свежесобранном состоянии или в переработанном виде, например, путем предварительного высушивания, увлажнения, измельчения, перемалывания, спрессовывания или высокотемпературной обработки. Товары для хранения также включают лесоматериалы, как сырые лесоматериалы, такие как строительные лесоматериалы, опоры линии электропередачи и ограждения, так и лесоматериалы в виде готовых изделий, такие как мебель. Складированной продукцией животного происхождения является, например, шкуры, кожа, меховые изделия и изделия из волосяной ткани меха. Активные ингредиенты по изобретению могут предотвращать негативные воздействия, такие как гниение, порча, изменение цвета, обесцвечивание или образование плесени.

Микроорганизмы, которые способны портить промышленные материалы или изменять их свойства, включают, например, бактерии, грибы, дрожжи, водоросли и

организмы, живущие в иле. Активные ингредиенты по изобретению предпочтительно обладают воздействием на грибы, в особенности, на плесень, на грибы, в результате воздействия которых происходит обесцвечивание или разрушение древесины (*Ascomycetes*, *Basidiomycetes*, *Deuteromycetes* и *Zygomycetes*), а также воздействием на организмы, живущие в иле, и водоросли. Примеры включают микроорганизмы следующих родов: *Alternaria*, такие как *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, такие как *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, такие как *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, такие как *Coniophora puetana*; *Lentinus*, такие как *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, такие как *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, такие как *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, такие как *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, такие как *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, такие как *Trichoderma viride*; *Ophiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Humicola* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp., *Coriolus* spp., *Gloeophyllum* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. и *Tyromyces* spp., *Cladosporium* spp., *Paecilomyces* spp. *Mucor* spp., *Escherichia*, такие как *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, такие как *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, такие как *Staphylococcus aureus*, *Candida* spp. и *Saccharomyces* spp., такие как *Saccharomyces cerevisiae*.

Фунгицидная активность

В дополнение, активные ингредиенты по изобретению обладают превосходной фунгицидной активностью. Они обладают чрезвычайно широким спектром противогрибкового действия, в особенности воздействием на дерматофиты и дрожжевые грибы, плесень и двухфазные грибы (например, на виды *Candida*, например, *C. albicans*, *C. glabrata*), и *Epidermophyton floccosum*, виды *Aspergillus*, например, *A. niger* и *A. fumigatus*, виды *Trichophyton*, например, *T. mentagrophytes*, виды *Microsporon*, например, *M. canis* и *M. audouinii*. Перечисление этих грибов ни в коем случае не представляет собой ограничение спектра противогрибкового действия, а носит лишь характер пояснения.

Таким образом, активные ингредиенты по изобретению могут применяться как в области медицины, так и в других областях.

ГМО

Как уже было сказано выше, согласно данному изобретению могут подвергаться обработке все растения и их части. В предпочтительном варианте

реализации изобретения обрабатывают растения, а также их части, сортов и видов, встречающихся в диком виде, или выведенных обычными биологическими методами, например, скрещиванием или синтезом протопластов. В соответствии с еще одним предпочтительным вариантом реализации обработке подвергаются трансгенные растения, полученные методами генной инженерии, при необходимости, в комбинации с обычными методами («генетически модифицированные организмы»), и части таких растений. Объяснение терминов «части» или «части растения» или «растительные части» было приведено выше. Более предпочтительно, в соответствии с настоящим изобретением обрабатываются растения сортов, которые являются коммерчески доступными или используемыми. Под термином «сорта растений» подразумеваются растения, обладающие новыми свойствами («характеристиками»), которые были получены методами обычного разведения, мутагенезом или с применением технологии рекомбинантных ДНК. Это могут быть сорта, разновидности био- или генотипы.

Способ обработки по изобретению можно использовать для обработки генетически модифицированных организмов (ГМО), например, растений или семян. Генетически модифицированными растениями (или трансгенными растениями) являются растения, у которых в геном устойчиво встроен гетерологичный ген. Выражение «гетерологичный ген» по существу, означает ген, который создан или собран вне растения, и который, при введении в ядерный, хлоропластный или митохондриальный геном, дает трансформированное растение с новыми или улучшенными агротехническими или другими свойствами, за счет экспрессии целевого белка или полипептида, или за счет отрицательной регуляции или сайленсинга другого (других) гена (генов), которые присутствуют в растении (с использованием, например, антисмысловой технологии, косупрессорной технологии или технологии РНК-интерференции (RNAi) или технологии микроРНК (miRNA)). Гетерологичный ген, который локализован в геноме, также называется трансгеном. Трансген, который определен конкретной локализацией в геноме растения, называют трансформационным или трансгенным объектом.

Растения и сорта растений, которые предпочтительно подвергаются обработке в соответствии с изобретением, включают все растения, имеющие генетический материал, который придает особенно преимущественные полезные

характеристики этим растениям (полученные селекцией и/или методами биотехнологии растений).

Растения и сорта растений, которые также предпочтительно подвергаются обработке в соответствии с изобретением, представляют собой такие растения, которые являются устойчивыми к одному или нескольким факторам биотического стресса, т.е. указанные растения проявляют повышенную устойчивость по отношению к животным-вредителям и микробальным вредителям, например, к нематодам, насекомым, клещам, фитопатогенным грибам, бактериям, вирусам и/или вириоидам.

Растения и сорта растений, которые также могут быть обработаны в соответствии с изобретением, представляют собой такие растения, которые являются устойчивыми к одному или нескольким факторам абиотического стресса. Условия абиотического стресса включают, например, засуху, высокие и низкие температуры, осмотический стресс, затопление, повышенная засоленность почвы, повышенное присутствие минералов в почве, присутствие экстраординарных количеств озона, избыточный свет, недостаток азотных или фосфорных питательных веществ, отсутствие затенения.

Растения и сорта растений, которые также могут быть обработаны в соответствии с изобретением, представляют собой такие растения, которые характеризуются улучшенными характеристиками урожайности. Улучшенная урожайность указанных растений может быть результатом, например, улучшенных показателей физиологии, роста и развития растения, таких как эффективность использования воды, эффективность влагоудерживания, улучшенная усвояемость азота, усиленная ассимиляция углерода, улучшенный фотосинтез, повышенная всхожесть и ускоренное созревание. На урожайность, кроме того, может оказывать влияние улучшение организации растений (при стрессовых и нестрессовых условиях), включая, помимо прочего, раннее начало цветения, контроль цветения для получения гибридных семян, всхожесть, размер растения, количество междоузлий и расстояние между ними, рост корневой системы, размер семян, размер плодов, размер стручков, количество стручков или колосьев, количество семян в стручке или колосе, масса семени, увеличение процентного отношения выполненных семян, сниженное осыпание семян, сниженное растрескивание стручков и устойчивость к полеганию. Другие характеристики урожайности

включают состав семян, например, содержание и композиция углеводов, например, хлопок или крахмал, содержание белков, масличность и состав жиров, пищевая ценность, сниженное содержание не обладающих пищевой ценностью веществ, улучшенная пригодность для переработки и лучшая устойчивость при хранении.

Растения, которые могут быть обработаны в соответствии с изобретением, представляют собой гибридные растения, которые уже проявляют признаки гетерозиса или гибридной силы, что в результате приводит в целом к улучшенной урожайности, силе, жизнеспособности и устойчивости к факторам биотического и абиотического стресса.

Растения или сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть обработаны согласно настоящему изобретению, являются растениями, устойчивыми к гербицидам, т.е. растениями, обладающими устойчивостью к одному или нескольким определенным гербицидам. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такую устойчивость к гербицидам.

Растения или сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть также обработаны согласно настоящему изобретению, являются трансгенные растения, устойчивые к насекомым, т.е. растения, которым была придана устойчивость к нападению некоторых целевых насекомых. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такую устойчивость к насекомым.

Растения или сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть также обработаны согласно настоящему изобретению, являются устойчивыми к факторам абиотического стресса. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такую устойчивость к стрессу.

Растения или сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть также обработаны согласно настоящему изобретению, демонстрируют измененные количественные и

качественные характеристики и/или характеристики устойчивости при хранении собранного продукта урожая и/или измененные характеристики определенных ингредиентов собранного продукта урожая.

Растения или сорта растений (которые могут быть получены методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть также обработаны согласно настоящему изобретению, представляют собой растения, такие как растения хлопчатника, с измененными характеристиками волокна. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такие измененные свойства волокну.

Растения или сорта растений (которые могут быть получены методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть также обработаны согласно настоящему изобретению, представляют собой растения, такие как масличный рапс и родственные растения Brassica, с измененными профильными свойствами масла. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такие измененные профильные свойства маслу.

Растения или сорта растений (которые могут быть получены методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть также обработаны согласно настоящему изобретению, представляют собой растения, такие как масличный рапс и родственные растения Brassica, с измененными характеристиками осыпания семян. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такие измененные характеристики осыпания семян, и включают растения, такие как масличный рапс с запоздалым или пониженным осыпанием семян.

Растения или сорта растений (которые могут быть получены методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть также обработаны согласно настоящему изобретению, представляют собой растения, такие как табак, с измененными профилями посттрансляционной модификации белка.

Дозы и время внесения

При использовании активных ингредиентов по изобретению в качестве фунгицидов дозировки могут варьироваться в пределах относительно широкого диапазона, в зависимости от вида применения. Доза внесения активных ингредиентов по изобретению составляет в случае обработки частей растения, например, листьев: 0,1 - 10 000 г/га, предпочтительно 10 - 1000 г/га, более предпочтительно 10 - 800 г/га, еще более предпочтительно 50 - 300 г/га (в случае обработки путем поливки или орошения, возможно еще более снизить дозировку, в особенности, если используются инертные субстраты, такие как минеральная вата или перлит);

в случае обработки семян: 2 - 200 г на 100 кг семян, предпочтительно 3 - 150 г на 100 кг семян, более предпочтительно 2,5 - 25 г на 100 кг семян, еще более предпочтительно 2,5 - 12,5 г на 100 кг семян;

в случае обработки почвы: 0,1 - 10 000 г/га, предпочтительно 1 - 5000 г/га,

Указанные дозировки приводятся исключительно в качестве примера и не ограничивают цели изобретения.

Таким образом, активные ингредиенты по изобретению или композиции, содержащие такой ингредиент, могут быть использованы для защиты растений от атаки указанных патогенов в течение определенного периода времени после обработки. Период, в течение которого обеспечивается защита, как правило, имеет продолжительность 1 - 28 дней, предпочтительно 1 - 14 дней, более предпочтительно 1 - 10 дней, наиболее предпочтительно 1 - 7 дней, после обработки растений активными ингредиентами, или до 200 дней после обработки семян.

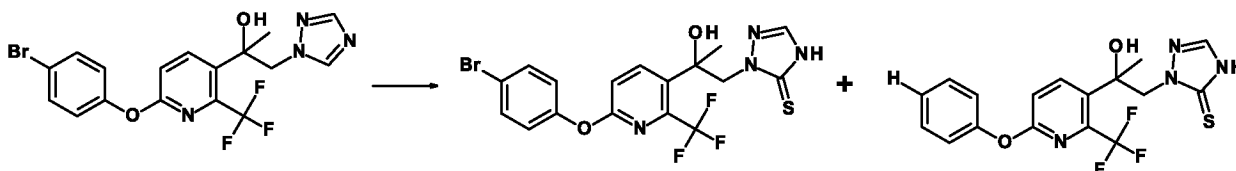
Обработке по изобретению соединениями общей формулы (II-S) и композициями по изобретению могут особенно предпочтительно подвергаться перечисленные растения. Указанные выше предпочтительные диапазоны для активных ингредиентов или композиций также относятся к обработке этих растений. Особое внимание уделяется обработке растений соединениями или композициями, специально указанными в тексте настоящего документа.

Настоящее изобретение поясняется следующими примерами. Тем не менее, изобретение не ограничено этими примерами.

Примеры получения

Получение соединений формулы (I-S) в соответствии со способом A-S:

Получение 2-[2-[6-(4-бромфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-2-гидрокси-пропил]-4H-1,2,4-триазол-3-тиона (I-S-01) и 2-[2-гидрокси-2-[6-фенокси-2-(трифторметил)-3-пиридил]пропил]-4H-1,2,4-триазол-3-тиона (I-S-02)

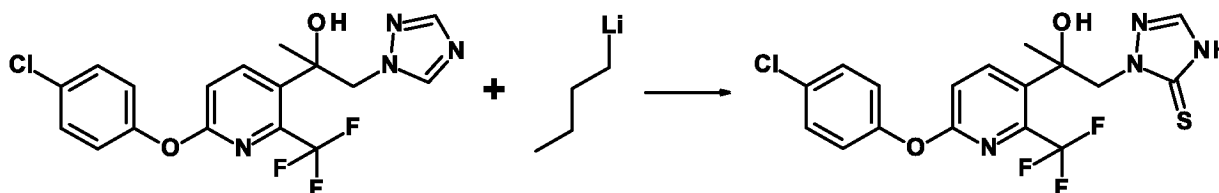


К раствору 2-[6-(4-бромфенокси)-2-(трифторметил)пиридин-3-ил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола (600 мг, 1.35 ммоль) в сухом ТГФ (тетрагидрофуран) (50 мл) при -78°C по каплям добавили раствор *n*-бутиллития (1.19 мл, 2.97 ммоль, 2.5 М в гексанах), поддерживая внутреннюю температуру ниже -70°C . Смесь перемешивали в течение 1 часа (ч) при -78°C , перед добавлением серы (130 мг, 4.06 ммоль), и полученную смесь перемешивали в течение дополнительных 2 ч при -78°C , перед тем как охлаждающую ванну удалили, и смесь нагрели до комнатной температуры (кт, 21°C) и перемешивали в течение еще 1 ч при кт. Реакцию затем резко охладили водой, экстрагировали дихлорметаном, промыли соляным раствором, высушили над Na_2SO_4 , и сконцентрировали. С помощью препаративной ВЭЖХ получили 50.5 мг (8% выхода, 99% чистоты) целевого соединения (I-S.01), и 84.5 мг (15% выхода, 97% чистоты) целевого соединения (I-S.02).

MS (ESI): 474.00 ($[\text{M}-\text{H}]^+$) для (I-S.01)

MS (ESI): 397.09 ($[\text{M}+\text{H}]^+$) для (I-S.02)

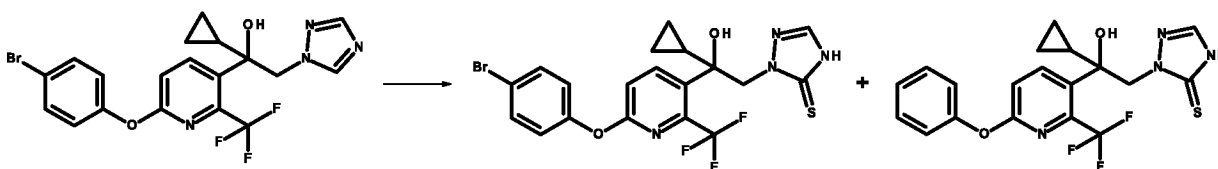
Получение 2-[2-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-2-гидрокси-пропил]-4H-1,2,4-триазол-3-тиона (I-S-03)



К раствору 2-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)пиридин-3-ил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола (187 мг, 0.469 ммоль) в сухом ТГФ (15 мЛ) при -78 °С по каплям добавили раствор *n*-бутиллития (0.413 мЛ, 1.03 ммоль, 2.5 М в гексанах), поддерживая внутреннюю температуру ниже -70 °С. Смесь перемешивали в течение 1 часа (ч) при -78 °С, перед добавлением серы (45.1 мг, 1.41 ммоль), и полученную смесь перемешивали в течение дополнительных 2 ч при -78 °С, перед тем как охлаждающую ванну удалили, и смесь нагрели до комнатной температуры (кт) и перемешивали в течение еще 1 ч при кт. Реакцию затем резко охладили водой, нейтрализовали путем добавления водного раствора 0.1 N HCl, экстрагировали дихлорметаном, промыли соляным раствором, высушили над Na₂SO₄, и сконцентрировали. С помощью препаративной ВЭЖХ получили 167 мг (75% выхода, 92% чистоты) целевого соединения.

MS (ESI): 431.05 ([M+H]⁺)

Получение 2-[2-[6-(4-бромфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-2-циклопропил-2-гидрокси-этил]-4H-1,2,4-триазол-3-тиона (I-S-04) и 2-[2-циклопропил-2-гидрокси-2-[6-фенокси-2-(трифторметил)-3-пиридил]этил]-4H-1,2,4-триазол-3-тиона (I-S-06)



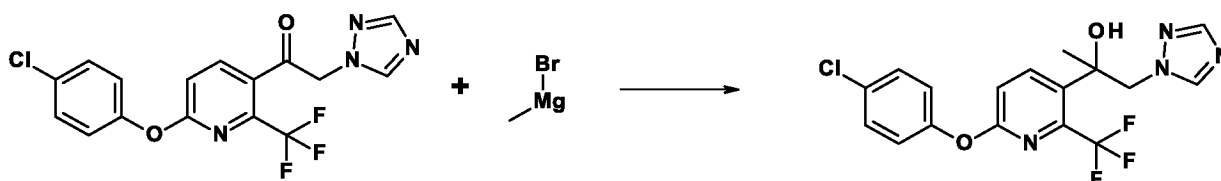
К раствору 1-[6-(4-бромфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-1-циклопропил-2-(1,2,4-триазол-1-ил)этанола (4.0 г, 8.52 ммоль) в сухом ТГФ (320 мЛ) при -78 °С по каплям добавили раствор *n*-бутиллития (6.14 мЛ, 15.3 ммоль, 2.5 М в гексанах), поддерживая внутреннюю температуру ниже -70 °С. Смесь перемешивали в течение 1 часа при -78 °С, перед добавлением серы (820 мг, 25.5 ммоль), и полученную смесь перемешивали в течение еще 1 ч при -78 °С, перед тем как охлаждающую ванну удалили, и смесь нагрели до комнатной температуры и перемешивали в течение еще 1 ч при кт. Реакцию затем резко охладили водой, экстрагировали дихлорметаном, промыли соляным раствором, высушили над Na₂SO₄, и сконцентрировали. С помощью препаративной ВЭЖХ получили 480 мг (13% выхода, 98% чистоты) целевого соединения (I-S-06), и 258 мг (5.6% выхода, 93% чистоты) целевого соединения (I-S-04).

MS (ESI): 501.01 ($[M]^+$) для (I-S-04)

MS (ESI): 422.10 ($[M]^+$) для (I-S-06)

Получение соединений формулы (I) в соответствии со способом А:

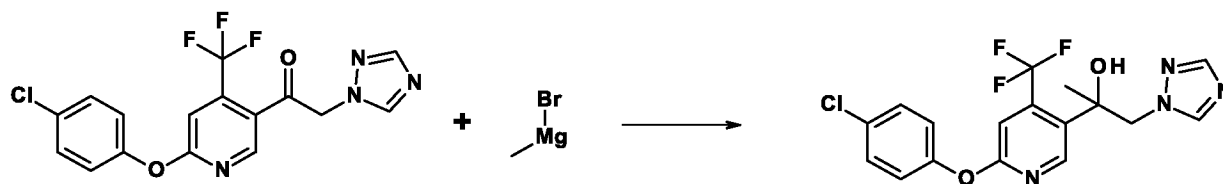
Получение 2-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)пиридин-3-ил]-1-(1Н-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола



Раствор комплекса этилового эфира и бромида магния (4.8 г, 18.8 ммоль) в дихлорметане (20 мЛ) и диэтиловом эфире (10 мЛ) охладили до 0 °С, перед тем как добавили раствор 1-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-2-(1,2,4-триазол-1-ил)этанона (1.80 г, 4.70 ммоль) в дихлорметане (10 мЛ) и перемешивали в течение 30 мин при 0 °С. Затем добавили метилмагния бромид (3.1 мЛ, 9.4 ммоль, 3М раствор в этиловом эфире), охлаждающую ванну удалили, и смесь перемешивали в течение 1.5 часов (ч) при 21°С (комнатная температура, кт), перед тем как смесь резко охладили водой, NH_4Cl (насыщенный водный раствор), экстрагировали дихлорметаном, высушили (над MgSO_4), и сконцентрировали. Поскольку исходный кетон и целевой спирт совпадают в условиях времени удерживания, сконцентрированный материал (примерно 2 г густого бесцветного масла, содержащего как кетон, так и спирт) растворили в пиридине (15.0 мЛ), и обрабатывали гидрохлоридом метоксиламина (313 мг, 3.75 ммоль) при кт в течение 20 ч (для преобразования кетона в соответствующий метилоксим, который имеет значительно отличающееся время удерживания). Затем смесь разбавили дихлорметаном, отфильтровали над ChemElut, и сконцентрировали. С помощью препаративной ВЭЖХ получили 319 мг (17% выхода в более чем два этапа, 99% чистоты) целевого соединения в виде бесцветного масла, которое затвердевало при отстаивании.

MS (ESI): 398.08 ($[M+H]^+$)

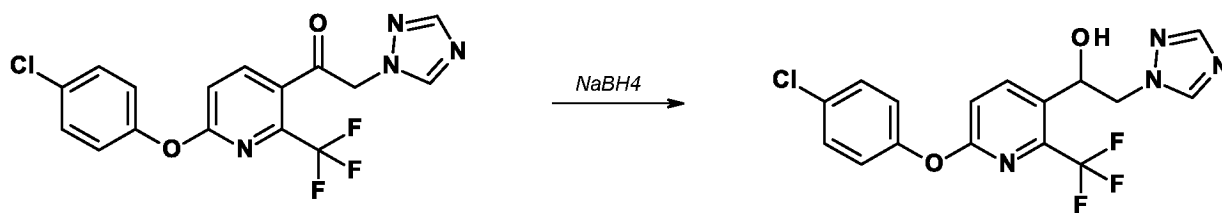
Получение 2-[6-(4-хлорфенокси)-4-(трифторметил)-3-пиридил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола



Раствор комплекса этилового эфира и бромида магния (1.2 г, 4.63 ммоль) в дихлорметане (10 мл) охладили до 0 °С, перед тем как добавили раствор 1-[6-(4-хлорфенокси)-4-(трифторметил)-3-пиридил]-2-(1,2,4-триазол-1-ил)этанона (443 мг, 1.16 ммоль) в дихлорметане (2 мл) и перемешивали в течение 30 мин при 0 °С. Затем добавили метилмагния бромид (0.78 мл, 2.3 ммоль, 3М раствор в этиловом эфире), охлаждающую ванну удалили, и смесь перемешивали в течение 1 ч при кт, перед тем как смесь резко охладили водой, экстрагировали дихлорметаном, высушили (над MgSO_4), и сконцентрировали. С помощью препаративной ВЭЖХ получили 126.6 мг (27% выхода, 100% чистоты) целевого соединения в виде бесцветного твердого вещества.

MS (ESI): 398.08 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

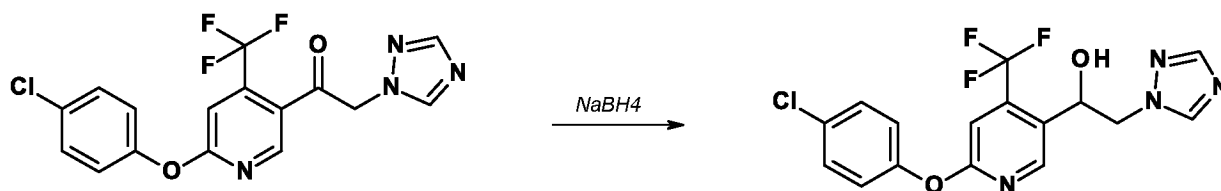
Получение 1-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-2-(1,2,4-триазол-1-ил)этанола



К раствору 1-[6-(4-хлорфенокси)-4-(трифторметил)-3-пиридил]-2-(1,2,4-триазол-1-ил)этанона (800 мг, 1.67 ммоль) в сухом метаноле (25.0 мл) при 5 °С добавили борогидрид натрия (127 мг, 3.3 ммоль), охлаждающую ванну удалили, смесь нагрели до кт и перемешивали в течение 1 ч. Смесь затем резко охладили водой, разбавили дихлорметаном, отфильтровали над ChemElut, и сконцентрировали. С помощью препаративной ВЭЖХ получили 286 мг (60% выхода, 100% чистоты) целевого соединения в виде бесцветного твердого вещества.

MS (ESI): 384.06 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

Получение 1-[6-(4-хлорфенокси)-4-(трифторметил)-3-пиридил]-2-(1,2,4-триазол-1-ил)этанона

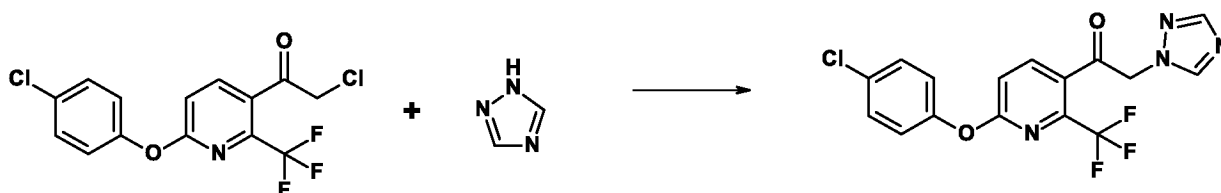


К раствору 1-[6-(4-хлорфенокси)-4-(трифторметил)-3-пиридил]-2-(1,2,4-триазол-1-ил)этанона (518 мг, 1.35 ммоль) в сухом метаноле (5.0 мл) при 5 °С добавили борогидрид натрия (102 мг, 2.7 ммоль), охлаждающую ванну удалили, смесь нагрели до кт и перемешивали в течение 1 ч. Смесь затем резко охладили водой, разбавили дихлорметаном, отфильтровали над ChemElut, и сконцентрировали. С помощью препаративной ВЭЖХ получили 252 мг (48% выхода, 100% чистоты) целевого соединения в виде бесцветного масла, которое кристаллизуется при выстаивании.

MS (ESI): 384.06 ([M+H]⁺)

Получение соединений формулы (VII) в соответствии со способом А:

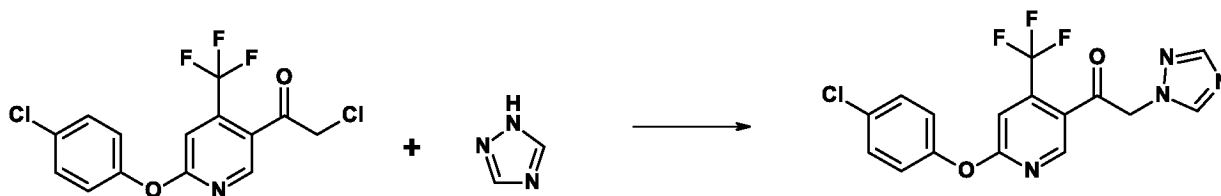
Получение 1-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-2-(1,2,4-триазол-1-ил)этанона



Смесь 2-хлор-1-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]этанона (8.3 г, 23.7 ммоль) и 1H-1,2,4-триазола (1.8 г, 26.0 ммоль) в ацетонитриле (80 мл) нагревали до 75 °С, перед тем как добавили карбонат калия (3.9 г, 28.5 ммоль). Нагревание продолжали в течение 20 минут (мин), перед тем как смесь быстро охладили до комнатной температуры путем добавления ледяной воды, экстрагировали дихлорметаном, высушили (над MgSO₄), и сконцентрировали. С помощью колоночной флэш-хроматографии (градиент, до DCM/10%MeOH в DCM=60/40, 254 нм) получили 4.30 г (43% выхода, 91% чистоты) целевого соединения в виде желтого стекла, которое использовали без дополнительной очистки на следующих этапах реакции. Небольшое количество далее очистили с помощью ВЭЖХ с получением целевого продукта (100% чистоты) в виде желтого твердого вещества.

MS (ESI): 382.04 ($[M+H]^+$)

Получение 1-[6-(4-хлорфенокси)-4-(трифторметил)-3-пиридил]-2-(1,2,4-триазол-1-ил)этанона

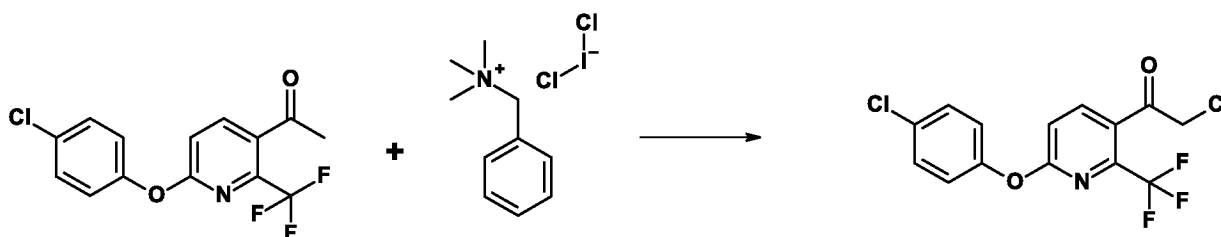


Смесь 2-хлор-1-[6-(4-хлорфенокси)-4-(трифторметил)-3-пиридил]этанона (3.4 г, 9.71 ммоль) и 1H-1,2,4-триазола (0.74 г, 10.6 ммоль) в ацетонитриле (50 мЛ) нагревали до 75 °С, перед тем как добавили карбонат калия (1.6 г, 11.6 ммоль). Нагревание продолжали в течение 20 мин, перед тем как смесь быстро охладили до комнатной температуры путем добавления ледяной воды, экстрагировали дихлорметаном, высушили (над $MgSO_4$), и сконцентрировали. С помощью колоночной флэш-хроматографии (градиент, до DCM/10%MeOH в DCM=70/30, 254 нм) с последующей препаративной ВЭЖХ получили 1.50 г (40% выхода, 100% чистоты) целевого соединения в виде желтого твердого вещества.

MS (ESI): 382.04 ($[M+H]^+$)

Получение соединений формулы (VI) в соответствии со способом А:

Получение 2-хлор-1-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]этанона

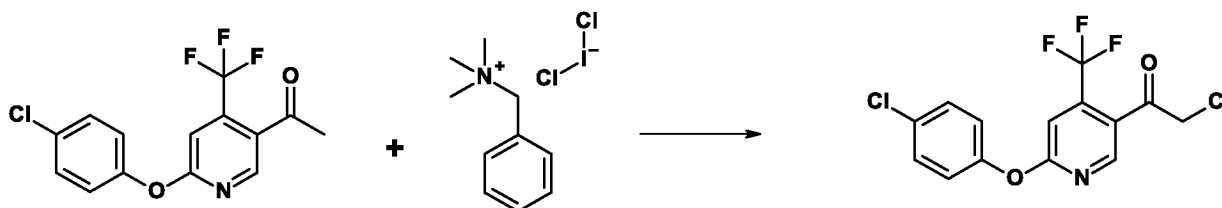


Смесь 1-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]этанона (8.6 г, 27.2 ммоль) и бензилтриметиламмоний дихлориодата (18.9 г, 54.4 ммоль) в 1,2-дихлорэтаноле (60 мЛ) и метаноле (20 мЛ) нагревали до 75 °С в течение 4 ч, перед тем как смесь сконцентрировали, затем разбавили этилацетатом, промыли $Na_2S_2O_3$ (10 мас./мас.% водного раствора), промыли соляным раствором, высушили (над $MgSO_4$), сконцентрировали, и пропустили над пробкой из силикагеля (гептан/этилацетат=1/1,

254 нм) с получением 8.3 г (83% выхода, 96% чистоты) целевого соединения в виде бледно-желтого твердого вещества.

MS (ESI): 348.99 ($[M+H]^+$)

Получение 2-хлор-1-[6-(4-хлорфенокси)-4-(трифторметил)-3-пиридил]этанона

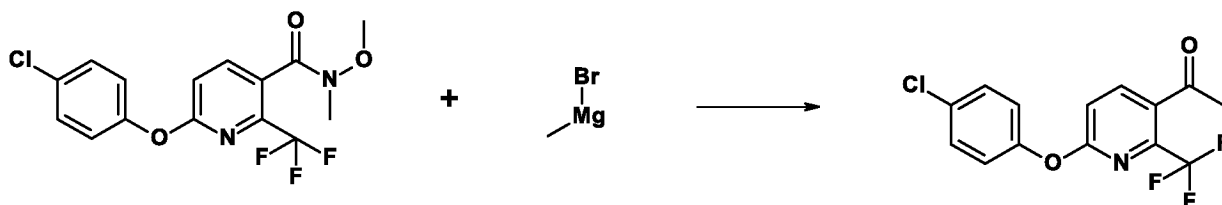


Смесь 1-[6-(4-хлорфенокси)-4-(трифторметил)-3-пиридил]этанона (3.6 г, 11.4 ммоль) и бензилтриметиламмоний дихлориодата (7.93 г, 22.8 ммоль) в 1,2-дихлорэтано (30 мЛ) и метаноле (10 мЛ) нагревали до 75 °С в течение 4 ч, перед тем как смесь сконцентрировали, затем разбавили этилацетатом, промыли $Na_2S_2O_3$ (10 мас./мас.% водного раствора), промыли соляным раствором, высушили (над $MgSO_4$), сконцентрировали, и пропустили над пробкой из силикагеля (гептан/этилацетат=85/15, 254 нм) с получением 3.4 г (58% выхода, 69% чистоты) целевого соединения в виде бесцветного масла, которое использовали без дополнительной очистки.

MS (ESI): 348.99 ($[M+H]^+$)

Получение соединений формулы (V) в соответствии со способом D:

Получение 1-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]этанона

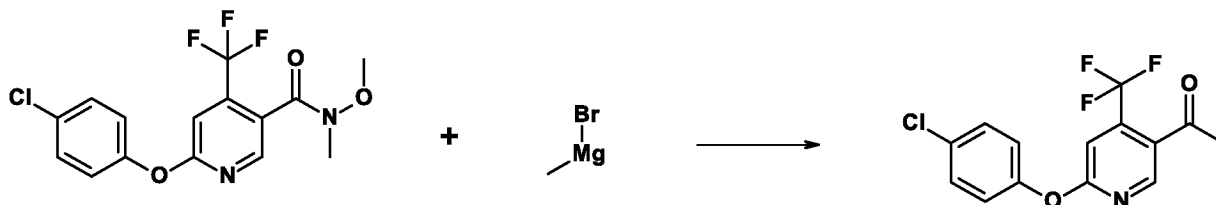


Раствор 6-(4-хлорфенокси)-N-метокси-N-метил-2-(трифторметил)пиридин-3-карбоксамид (11.5 г, 31.9 ммоль) в ТГФ (150 мЛ) при 5 °С обработали бромидом магния (21.2 мЛ, 63.7 ммоль, 3М раствор в диэтиловом эфире). Затем смесь нагрели до кт, и перемешивание продолжали в течение 4 ч при кт, перед тем как реакцию резко охладили водой, NH_4Cl (насыщенный водный раствор), экстрагировали дихлорметаном, высушили (над Na_2SO_4), и сконцентрировали с

получением 8.60 г (82% выхода, 96% чистоты) целевого соединения в виде бледно-желтого твердого вещества, которое использовали без дополнительной очистки.

MS (ESI): 315.03 ($[M+H]^+$)

Получение 1-[6-(4-хлорфенокси)-4-(трифторметил)-3-пиридил]этанона

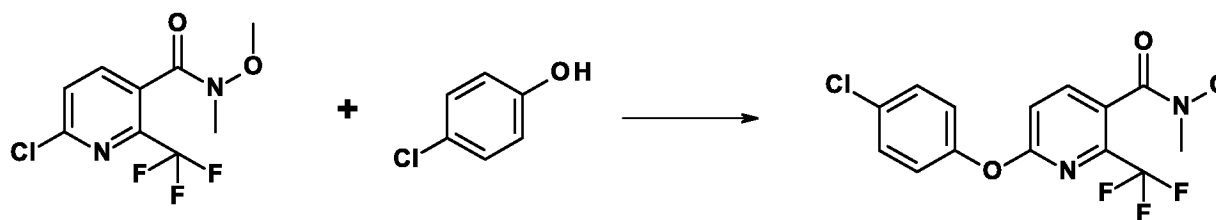


Раствор 6-(4-хлорфенокси)-N-метокси-N-метил-4-(трифторметил)пиридин-3-карбоксамида (6.9 г, 17.4 ммоль) в ТГФ (100 мЛ) при 5 °С обработали бромидом метилмагния (11.6 мЛ, 34.8 ммоль, 3М раствор в диэтиловом эфире). Затем смесь нагрели до кт, и перемешивание продолжали в течение 4 ч при кт, перед тем как реакцию резко охладили водой, NH_4Cl (насыщенный водный раствор), экстрагировали дихлорметаном, высушили (над Na_2SO_4), и сконцентрировали. С помощью колоночной флэш-хроматографии (градиент, до гептан/этилацетат=80/20, 254 нм) получили 3.60 г (61% выхода, 94% чистоты) целевого соединения в виде бесцветного масла.

MS (ESI): 315.03 ($[M+H]^+$)

Получение соединений формулы (XVI) в соответствии со способом D:

Получение 6-(4-хлорфенокси)-N-метокси-N-метил-2-(трифторметил)пиридин-3-карбоксамида

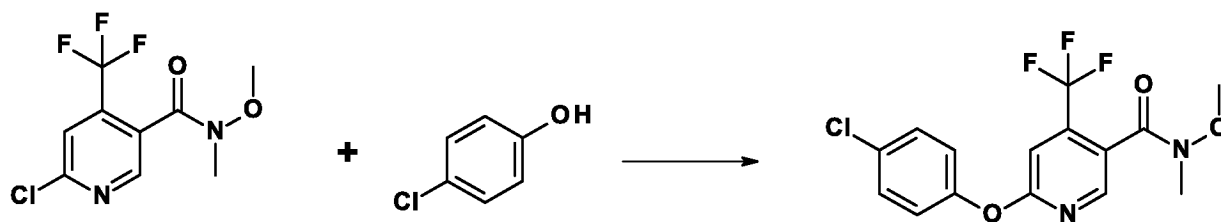


Смесь 6-хлор-N-метокси-N-метил-2-(трифторметил)пиридин-3-карбоксамида (9.0 г, 33.5 ммоль), 4-хлорфенола (4.3 г, 33.5 ммоль), карбоната калия (11.5 г, 83.7 ммоль), йодида меди(I) (638 мг, 3.35 ммоль), и N,N,N',N' -тетраметилэтилендиамина (TMEDA; 1.0 мЛ, 6.7 ммоль) в диметилсульфоксиде (DMSO; 150 мЛ) нагревали в течение 3 ч при 100 °С. Реакционную смесь затем охладили до кт, добавили воду, экстрагировали этилацетатом, высушили (над Na_2SO_4), сконцентрировали и

пропустили над пробкой из силикагеля (гептан/этилацетат=1/1, 254 нм) с получением 7.7 г (58% выхода, 91% чистоты) целевого соединения в виде жедтого масла.

MS (ESI): 360.05 ($[M+H]^+$)

Получение 6-(4-хлорфенокси)-N-метокси-N-метил-4-(трифторметил)пиридин-3-карбоксамид

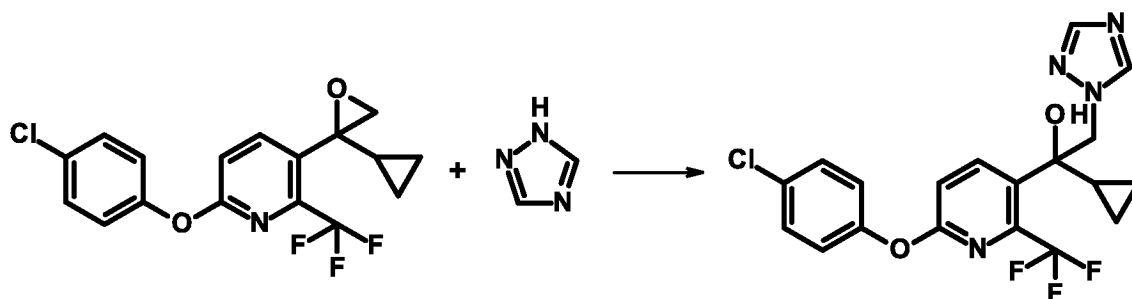


Смесь 6-хлор-N-метокси-N-метил-4-(трифторметил)пиридин-3-карбоксамид (5.7 г, 21.3 ммоль), 4-хлорфенола (2.7 г, 21.3 ммоль), карбоната калия (7.4 г, 53.3 ммоль), йодида меди(I) (406 мг, 2.13 ммоль), и TMEDA (0.64 мЛ, 4.26 ммоль) в DMSO (100 мЛ) нагревали в течение 3 ч при 100 °С. Реакционную смесь затем охладили до кт, добавили воду, экстрагировали этилацетатом, высушили (над Na₂SO₄), сконцентрировали и пропустили над пробкой из силикагеля (гептан/этилацетат=1/1, 254 нм) с получением 6.59 г (85% выхода, 100% чистоты) целевого соединения в виде бесцветного масла.

MS (ESI): 360.05 ($[M+H]^+$)

Получение соединений формулы (I) в соответствии со способом В:

Получение 1-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-1-циклопропил-2-(1,2,4-триазол-1-ил)этанола в соответствии со способом В

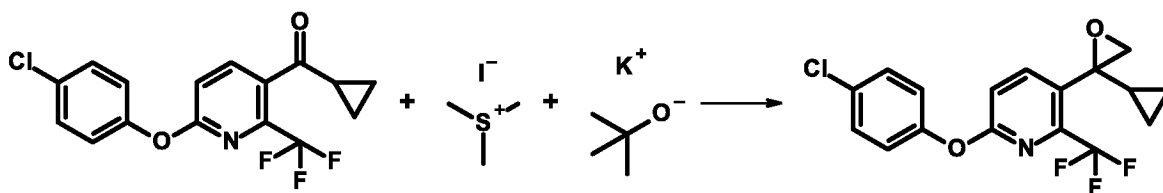


Эпоксид IX.07 (1.0 г, 2.81 ммоль), 1H-1,2,4-триазол (194 мг, 2.81 ммоль), гидроксид натрия (40 мг, 0.984 ммоль), 0.013 мЛ воды в ДМФ (10 мЛ) нагревали при 120 °С в течение 22 ч, перед тем как добавили воду, NH₄Cl (насыщенный водный раствор) и

CH_2Cl_2 . Фазы разделили, водную фазу экстрагировали дважды CH_2Cl_2 , объединенные органические экстракты высушили над Na_2SO_4 и сконцентрировали с получением, после очистки с помощью препаративной ВЭЖХ, необходимого спирта I.91 (362 мг, 30%) в виде бесцветного масла.

MS (ESI): 425.09 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

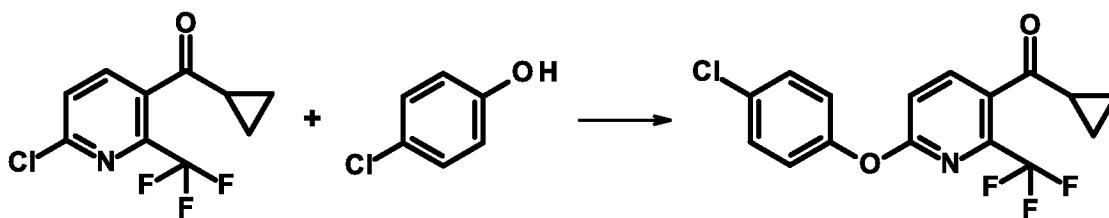
Получение 6-(4-хлорфенокси)-3-(2-циклопропилоксиран-2-ил)-2-(трифторметил)пиридина в соответствии со способом В



К суспензии триметилсульфоний йодида (3.1 г, 15.2 ммоль) в ТГФ (100 мЛ) при 0°C добавили трет-бутоксид калия (1.7 г, 15.2 ммоль) одной порцией, и смесь перемешивали в течение 5 мин. Затем добавили кетон V.41 (4.0 г, 11.7 ммоль) в ТГФ (10 мЛ), смесь нагрели до комнатной температуры и перемешивали в течение 1.5 ч. Затем добавили воду и CH_2Cl_2 , водную фазу экстрагировали CH_2Cl_2 , объединенные органические экстракты высушили над Na_2SO_4 и сконцентрировали, с получением, после колоночной флэш-хроматографии, необходимого эпоксида IX.07 (138 мг, 3%) в виде бесцветного масла.

MS (ESI): 356.06 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

Получение [6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-циклопропилметанона в соответствии со способом В

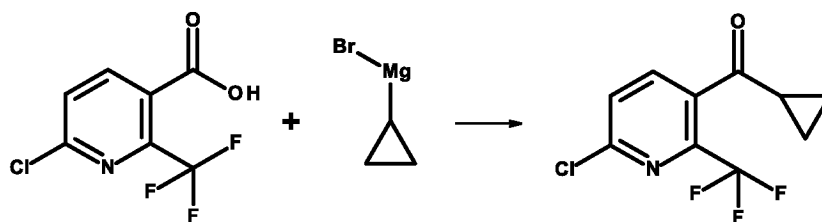


Смесь [6-хлор-2-(трифторметил)пиридин-3-ил](циклопропил)метанона (6.0 г, 24.0 ммоль), 4-хлорфенола (3.1 г, 24.0 ммоль), карбоната калия (8.3 г, 60.1 ммоль), йодида меди(I) (458 мг, 2.40 ммоль), и N,N,N',N'-тетраметилэтилендиамина (TMEDA; 0.7 мЛ, 4.8 ммоль) в диметилсульфоксиде (DMSO; 100 мЛ) нагревали в течение 2 ч при 100°C . Реакционную смесь затем охладили до кт, добавили воду, экстрагировали

этилацетатом, высушили (над Na_2SO_4), сконцентрировали и пропустили над пробкой из силикагеля (гептан/этилацетат=1/1, 254 нм), и перекристаллизовали из CH_2Cl_2 и диизопропилового эфира с получением 4.2 г (48% выхода, 95% чистоты) целевого соединения V.41 в виде бесцветного твердого вещества.

MS (ESI): 342.04 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

Получение [6-хлор-2-(трифторметил)-3-пиридил]-циклопропил-метанона

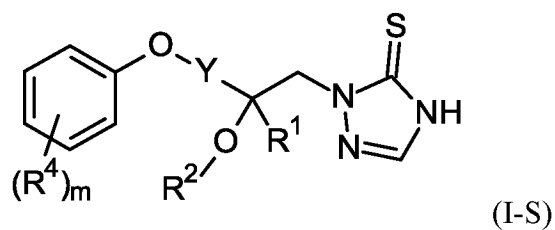


Раствор 6-хлор-2-(трифторметил)пиридин-3-карбоновой кислоты (6.0 г, 26.6 ммоль), тионилхлорида (3.9 мл, 53.2 ммоль) и нескольких капель диметилформамида в дихлорэтано (100 мл) нагревали при 85 °С в течение 4 ч, перед тем как смесь охладил до кт и сконцентрировали. Затем добавили сухой ТГФ (150 мл) и $\text{Fe}(\text{acac})_3$ (470 мг, 1.33 ммоль), и раствор охладил до -78 °С, перед тем как каплями добавили раствор бромида циклопропилмагния (69 мл, 0.5 М, 34.6 ммоль), поддерживая внутреннюю температуру ниже -70 °С. после полного добавления, охлаждающую ванну удалили, и реакционной смеси дали нагреться до комнатной температуры. Реакцию затем резко охладил NH_4Cl (насыщенный водный раствор) и экстрагировали CH_2Cl_2 , высушили над Na_2SO_4 и сконцентрировали. Целевое соединение [6-хлор-2-(трифторметил)пиридин-3-ил](циклопропил)метанон (6.0 г, 87% выхода) использовали на следующем этапе без дополнительной очистки.

MS (ESI): 250.02 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

Нижеследующие таблицы иллюстрируют не имеющим ограничительного характера образом примеры соединений по изобретению, а также их промежуточных соединений. Эти соединения получены в соответствии с описанными выше способами получения.

Таблица 1: Соединения в соответствии с формулой (I-S)



Прим. №	Y	n	R ³	R	R ¹	R ²	m	R ⁴	LogP
I-S-01		0	-	CF ₃	CH ₃	H	1	4-Br	3.21 ^[a]
I-S-02		0	-	CF ₃	CH ₃	H	0	-	2.66 ^[a]
I-S-03		0	-	CF ₃	CH ₃	H	1	4-Cl	3.11 ^[a]
I-S-04		0	-	CF ₃	циклопропил	H	1	4-Br	3.87 ^[a]
I-S-05		0	-	CF ₃	CH ₃	H	1	4-CF ₃	3.18 ^[a]
I-S-06		0	-	CF ₃	циклопропил	H	0	-	3.27 ^[a]

Значения LogP:

Измерение значений logP осуществляли в соответствии с Директивой ЕС 79/831/ЕЭС, Приложение V.A8 путем ВЭЖХ (высокоэффективная жидкостная хроматография) на колонках с обращенными фазами с использованием следующих методов:

^[a] Значение LogP определяют посредством измерения LC-UV в кислотном диапазоне использованием 0,1 % муравьиной кислоты в воде и

ацетонитрила в качестве элюента (линейный градиент от 10 % до 95 % ацетонитрила).

^[b] Значение LogP определяют посредством измерения LC-UV в нейтральном диапазоне с использованием 0,001 молярного раствора ацетата аммония в воде и ацетонитрила в качестве элюента (линейный градиент от 10 % до 95 % ацетонитрила).

^[c] Значение LogP определяют посредством измерения LC-UV в кислотном диапазоне с использованием 0,1 % фосфорной кислоты и ацетонитрила в качестве элюента (линейный градиент от 10 % до 95 % ацетонитрила).

Если в рамках одного и того же метода имеется несколько значений LogP, то приведены все значения, которые записаны через знак "+".

Калибровку осуществляли с использованием неразветвленных алкан-2-онов (с 3 - 16 атомами углерода) с известными значениями LogP (измерение значений LogP с использованием времени удержания с линейной интерполяцией между последовательными алканонами). Максимальные лямбда-значения определяли с использованием УФ-спектров от 200 нм до 400 нм и пиковых значений хроматографических сигналов.

Перечень пиков ЯМР

Данные ¹H-NMR выбранных примеров приведены в форме перечней пиков ¹H-NMR. Для каждого пика сигнала указаны δ -значение в ppm и интенсивность сигнала в круглых скобках. Между парами δ -значение – интенсивность сигнала в качестве разделителя поставлена точка с запятой.

Таким образом, перечень пиков имеет следующую форму:

δ_1 (интенсивность₁); δ_2 (интенсивность₂);.....; δ_i (интенсивность_i);.....; δ_n (интенсивность_n)

Интенсивность острых сигналов взаимосвязана с высотой сигналов в отпечатанном спектре ЯМР в см и показывает фактические отношения интенсивности сигналов. Из широких сигналов могут быть показаны несколько пиков или середина сигнала, а также их относительная интенсивность в сравнении с наиболее интенсивным сигналом в спектре.

Для калибровки химического сдвига для ^1H спектров, мы использовали тетраметилсилан и/или химический сдвиг используемого растворителя, в частности, в случае спектров, измерение которых осуществляли в DMSO. Таким образом, в перечнях пиков NMR могут появляться пики тетраметилсилана, но не обязательно.

Перечни пиков ^1H -NMR аналогичны классическим отпечаткам ^1H -NMR и, таким образом, обычно включают все пики, которые перечислены при классической NMR-интерпретации.

Дополнительно могут быть показаны, например, классические сигналы ^1H -NMR отпечатков растворителей, стереоизомеров целевых соединений, которые также являются целью изобретения, и/или пики примесей.

Для того чтобы показать сигналы соединений в дельта-диапазоне растворителей и/или воды показаны обычные пики растворителей, например, пики DMSO в DMSO- D_6 и пик воды в наших перечнях пиков ^1H -NMR, которые обычно в среднем имеют высокую интенсивность.

Пики стереоизомеров целевых соединений и/или пики примесей обычно в среднем имеют более низкую интенсивность, чем пики целевых соединений (например, с чистотой $>90\%$).

Такие стереоизомеры и/или примеси могут быть типичными для определенных способов получения. Таким образом, их пики могут помочь исследовать воспроизведение способов получения по нашему изобретению с помощью "отпечатков пальцев побочных продуктов".

Специалист, рассчитывающий пики целевых соединений известными методами (MestreC, ACD-симуляция, а также с определенными эмпирически ожидаемыми значениями), может выделить пики целевых соединений, при необходимости, с использованием дополнительных фильтров интенсивности. Такое выделение пиков аналогично выбору соответствующих пиков при классической ^1H -ЯМР интерпретации.

Более подробная информация по описанию данных ЯМР с перечнем пиков приведена в публикации "Перечисление данных по перечням пиков ЯМР в патентных заявках" в базе данных Research Disclosure Database, № 564025.

I-S-01: $^1\text{H-NMR}$ (300.2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 13.4298 (2.5); 8.3095 (14.3); 7.8529 (3.6); 7.8238 (4.0); 7.6596 (1.0); 7.6485 (9.8); 7.6413 (3.2); 7.6261 (3.4); 7.6188 (11.0); 7.6078 (1.2); 7.1950 (6.1); 7.1889 (12.0); 7.1816 (3.8); 7.1662 (7.8); 7.1592 (10.2); 7.1481 (1.1); 5.7176 (11.6); 4.5593 (2.7); 4.5136 (4.2); 4.3915 (4.5); 4.3458 (2.9); 3.3500 (11.4); 2.5338 (2.3); 2.5279 (4.8); 2.5218 (6.5); 2.5157 (4.7); 2.5098 (2.2); 2.0944 (6.6); 1.6900 (16.0); 1.6369 (0.4); 0.0180 (3.8)

I-S-02: $^1\text{H-NMR}$ (300.2 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1013 (3.2); 8.0719 (3.4); 7.8101 (5.1); 7.4533 (2.6); 7.4469 (1.3); 7.4280 (5.4); 7.4009 (4.4); 7.3055 (1.3); 7.2764 (2.1); 7.2519 (3.3); 7.2263 (2.7); 7.2208 (5.4); 7.2169 (6.2); 7.1917 (4.8); 6.9820 (4.0); 6.9527 (3.9); 5.3272 (3.7); 4.8974 (2.6); 4.8492 (3.3); 4.5615 (3.4); 4.5131 (2.7); 1.7333 (16.0); 1.7080 (0.6); 1.6845 (0.6); 1.2988 (0.6); 1.2765 (0.5); 0.0374 (1.1)

I-S-03: $^1\text{H-NMR}$ (300.2 MHz, CDCl_3):

δ = 11.6984 (0.6); 8.1558 (3.0); 8.1265 (3.2); 7.7995 (8.7); 7.4180 (0.7); 7.4073 (6.1); 7.4001 (2.2); 7.3849 (2.5); 7.3776 (8.1); 7.3669 (1.0); 7.2988 (14.9); 7.2082 (1.0); 7.1976 (8.0); 7.1903 (2.5); 7.1750 (2.2); 7.1679 (6.0); 7.1571 (0.6); 7.0520 (3.7); 7.0228 (3.5); 5.3375 (3.2); 4.9178 (2.7); 4.8695 (3.5); 4.7481 (4.0); 4.5717 (3.8); 4.5233 (3.0); 3.8215 (0.4); 3.7996 (0.9); 3.7778 (0.4); 2.0478 (1.1); 1.9227 (0.4); 1.9120 (0.4); 1.9010 (1.0); 1.8895 (0.4); 1.8791 (0.4); 1.7352 (16.0); 1.6968 (7.0); 0.1065 (4.6); 0.0471 (0.7); 0.0364 (14.0); 0.0255 (0.6)

I-S-04: $^1\text{H-NMR}$ (300.2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 13.5521 (1.3); 8.3204 (11.0); 8.3148 (2.3); 8.2024 (3.0); 8.1730 (3.2); 8.0010 (0.3); 7.9725 (0.4); 7.6626 (0.9); 7.6516 (8.2); 7.6444 (2.7); 7.6291 (2.8); 7.6218 (9.4); 7.6109 (1.0); 7.2466 (4.2); 7.2177 (4.8); 7.2077 (9.8); 7.2004 (3.0); 7.1852 (2.7); 7.1779 (8.3); 7.1669 (0.8); 6.8887 (0.5); 6.8594 (0.5); 5.2347 (7.4); 5.1129 (0.9); 4.6564 (0.4); 4.6081 (7.4); 4.5592 (0.4); 3.3402 (16.0); 2.5345 (4.9); 2.5285 (10.2); 2.5224 (13.9); 2.5163 (10.1); 2.5104 (4.9); 1.7887 (0.3); 1.7703 (0.7); 1.7612 (0.9); 1.7442 (1.3); 1.7269 (0.9); 1.7175 (0.8); 1.6994 (0.4); 1.5717 (8.4); 0.6867 (0.8); 0.6712 (1.2); 0.6549 (1.3); 0.6411 (1.0); 0.6254 (0.5); 0.4123 (0.9); 0.3939 (1.1); 0.3834 (1.2); 0.3649 (0.9); 0.3551 (1.1); 0.3450 (1.0); 0.3271 (1.4); 0.3161 (1.3); 0.2995 (1.1); 0.2819 (0.6); 0.2703 (0.4); 0.2408 (0.5); 0.2227 (1.0); 0.2116 (1.4); 0.1925 (1.4); 0.1805 (0.8); 0.0313 (0.6); 0.0204 (14.2); 0.0095 (0.6); -0.0444 (0.3)

I-S-05: $^1\text{H-NMR}$ (300.2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 13.4289 (1.1); 8.3178 (7.9); 7.8823 (2.0); 7.8530 (2.7); 7.8450 (3.4); 7.8163 (3.5); 7.4130 (3.4); 7.3850 (3.0); 7.2874 (2.8); 7.2584 (2.6); 5.7623 (6.4); 4.5789 (1.5); 4.5332 (2.3); 4.3911 (2.4); 4.3453 (1.7); 3.3483 (16.0); 2.5343 (2.3); 2.5283 (4.9); 2.5222 (6.7); 2.5162 (4.9); 2.5102 (2.3); 2.0953 (1.4); 1.7106 (8.8); 0.0193 (8.6)

I-S-06: $^1\text{H-NMR}$ (499.9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8.1519 (1.9); 8.1343 (2.0); 7.3149 (1.9); 7.3112 (1.2); 7.2997 (3.2); 7.2979 (3.7); 7.2867 (1.0); 7.2830 (2.7); 7.2187 (3.3); 7.1136 (1.2); 7.1116 (1.0); 7.0988 (2.0); 7.0839 (0.9); 7.0820 (0.7); 7.0559 (2.9); 7.0538 (3.9); 7.0386 (3.2); 7.0368 (3.1); 6.9947 (2.4); 6.9772 (2.4); 6.6172 (1.7); 4.5602 (1.7); 4.5317 (2.3); 4.3668 (2.2); 4.3383 (1.7); 3.8960 (0.6); 3.8817 (0.6); 2.3666 (11.2); 2.3630 (16.0); 2.3595 (13.5); 1.8533 (0.3); 1.8487 (2.5); 1.7627 (0.8); 1.4058 (1.7); 1.3737 (0.5); 1.3685 (0.7); 1.3577 (1.0); 1.3478 (0.7); 1.3425 (0.6); 1.0482 (0.7); 1.0340 (1.3); 1.0198 (0.7); 0.3853 (0.6); 0.3775 (0.9); 0.3676 (0.9); 0.3589 (0.6); 0.3492 (0.3); 0.1066 (0.6); 0.1048 (0.6); 0.0998 (0.6); 0.0950 (0.8); 0.0906 (0.8); 0.0876 (0.8); 0.0783 (0.5); 0.0708 (0.4); 0.0277 (0.5); 0.0245 (0.5); 0.0170 (0.8); 0.0112 (1.2); -0.0002 (1.4); -0.0068 (1.2); -0.0183 (1.1); -0.0251 (0.5); -0.0303 (0.5)

Примеры применения

Пример А: *in vivo* профилактическое испытание на *Botrytis cinerea* (серая гниль)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1 мкл Tween[®] 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты сделали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/ацетона/Tween[®] 80 и затем разбавили в воде до необходимой концентрации.

Молодые растения огурца обработали распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором ацетона/диметилсульфоксида/Tween[®] 80.

Через 24 часа, растения заразили путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Botrytis cinerea*. Зараженные растения огурцов инкубировали в течение 4 - 5 дней при температуре 17°C и при 90% относительной влажности.

Испытание оценивали через 4 - 5 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что никакого заболевания не наблюдалось.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-01; I-S-02; I-S-03; I-S-05; I-S-06.

Пример В: *in vivo* профилактическое испытание на *Puccinia recondita* (бурая ржавчина на пшенице)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1 мкл Tween[®] 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты сделали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/ацетона/Tween[®] 80 и затем разбавили в воде до необходимой концентрации.

Молодые растения пшеницы обработали распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором ацетона/диметилсульфоксида/Tween® 80.

Через 24 часа, растения заразили путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Puccinia recondita*. Зараженные растения пшеницы инкубировали в течение 24 часов при температуре 20°C и при 100% относительной влажности и затем в течение 10 дней при температуре 20°C и при 70 - 80% относительной влажности.

Испытание оценивали через 11 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что никакого заболевания не наблюдалось.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-01; I-S-03; I-S-04; I-S-05; I-S-06.

Пример С: *in vivo* профилактическое испытание на *Septoria tritici* (пятнистость листьев на пшенице)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1 мкл Tween® 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты сделали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/ацетона/Tween® 80 и затем разбавили в воде до необходимой концентрации.

Молодые растения пшеницы обработали распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором ацетона/диметилсульфоксида/Tween® 80.

Через 24 часа, растения заразили путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Septoria tritici*. Зараженные растения пшеницы инкубировали в течение 72 часов при 18°C и при 100% относительной влажности и затем в течение 21 дня при температуре 20°C и при 90% относительной влажности.

Испытание оценивали через 24 дня после инокуляции. 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что никакого заболевания не наблюдалось.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 80% до 89% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-06.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-01; I-S-02; I-S-03; I-S-04; I-S-05.

Пример D: *in vivo* профилактическое испытание на *Sphaerotheca fuliginea* (мучнистая роса на бахчевых культурах)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1 мкл Tween[®] 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты сделали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/ацетона/Tween[®] 80 и затем разбавили в воде до необходимой концентрации.

Молодые растения огурца обработали распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором ацетона/диметилсульфоксида/Tween[®] 80.

Через 24 часа, растения заразили путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Sphaerotheca fuliginea*. Зараженные растения огурцов инкубировали в течение 72 часов при 18°C и при 100% относительной влажности и затем в течение 12 дней при температуре 20°C и при 70 - 80% относительной влажности.

Испытание оценивали через 15 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что никакого заболевания не наблюдалось.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-01; I-S-02; I-S-03; I-S-04; I-S-05; I-S-06.

Пример E: *in vivo* профилактическое испытание на *Uromyces appendiculatus* (ржавчина бобовых)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1 мкл Tween® 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты сделали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/ацетона/Tween® 80 и затем разбавили в воде до необходимой концентрации.

Молодые растения бобов обработали распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором ацетона/диметилсульфоксида/Tween® 80.

Через 24 часа, растения заразили путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Uromyces appendiculatus*. Зараженные растения бобов инкубировали в течение 24 часов при температуре 20°C и при 100% относительной влажности и затем в течение 10 дней при температуре 20°C и при 70 - 80% относительной влажности.

Испытание оценивали через 11 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что никакого заболевания не наблюдалось.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 70% до 79% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-06.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-01; I-S-03; I-S-04; I-S-05.

Пример F: *in vivo* профилактическое испытание на *Phakopsora* (соя)

Растворитель: 24.5 массовых частей ацетона

24.5 массовых частей диметилацетамида

Эмульгатор: 1 массовая часть алкиларил полигликолевого эфира

Для получения соответствующего препарата активного соединения 1 массовую часть активного соединения смешали с определенными количествами

растворителя и эмульгатора, и концентрат разбавили водой до необходимой концентрации.

Для проверки на профилактическую активность, молодые растения опрыскивали препаратом активного соединения при определенной дозе внесения. После высыхания нанесенного распылением покрытия растения инокулировали водной суспензией спор возбудителя заболевания ржавчины сои (*Phakopsora pachyrhizi*) и оставили на 24ч без света в камере для инкубирования при температуре приблизительно 24°C и относительной атмосферной влажности 95 %.

Растения оставляли в камере для инкубирования при температуре приблизительно 24°C и относительной атмосферной влажности приблизительно 80 %, и интервале день/ночь 12ч.

Испытание оценивали через 7 дней после инокуляции. 0% означает эффективности, которая соответствует эффективности необработанного контрольного растения, в то время как эффективность 100% означает, что никакого заболевания не наблюдалось.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 100 ч./млн. активного ингредиента: I-S-01; I-S-03.

Пример G: *in vivo* профилактическое испытание на *Venturia* (яблони)

Растворитель: 24.5 массовых частей ацетона

24.5 массовых частей диметилацетамида

Эмульгатор: 1 массовая часть алкиларил полиглицевого эфира

Для получения соответствующего препарата активного соединения 1 массовую часть активного соединения смешали с определенными количествами растворителя и эмульгатора, и концентрат разбавили водой до необходимой концентрации.

Для проверки на профилактическую активность, молодые растения опрыскивали препаратом активного соединения при определенной дозе внесения. После высыхания нанесенного распылением покрытия растения инокулировали водной суспензией конидии возбудителя заболевания парши яблони (*Venturia inaequalis*)

и затем оставили на 1 дня в камере для инкубирования при температуре приблизительно 20°C и относительной атмосферной влажности 100%.

Затем растения поместили в теплицу при температуре приблизительно 21°C и относительной атмосферной влажности приблизительно 90%.

Испытание оценивали через 10 дней после инокуляции. 0% означает эффективности, которая соответствует эффективности необработанного контрольного растения, в то время как эффективность 100% означает, что никакого заболевания не наблюдалось.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 100 ч./млн. активного ингредиента: I-S-01; I-S-03; I-S-05.

Пример H: *in vivo* профилактическое испытание на *Blumeria* (ячмень)

Растворитель: 49 массовых частей N,N-диметилацетамида

Эмульгатор: 1 массовая часть алкиларил полигликолевого эфира

Для получения соответствующего препарата активного соединения 1 массовую часть активного соединения смешали с определенными количествами растворителя и эмульгатора, и концентрат разбавили водой до необходимой концентрации.

Для проверки на профилактическую активность, молодые растения опрыскивали препаратом активного соединения при определенной дозе внесения.

После высыхания нанесенного распылением покрытия растения посыпали спорами *Blumeria graminis f.sp. hordei*.

Растения поместили в теплицу при температуре приблизительно 18°C и относительной атмосферной влажности приблизительно 80%, чтобы способствовать развитию пустул мучнистой росы.

Испытание оценивали через 7 дней после инокуляции. 0% означает эффективности, которая соответствует эффективности необработанного контрольного растения, в то время как эффективность 100% означает, что никакого заболевания не наблюдалось.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-01; I-S-03; I-S-04; I-S-05.

Пример I: *in vivo* профилактическое испытание на *Colletotrichum lindemuthianum* (пятнистость листьев на бобах)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1 мкл Tween® 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты сделали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/ацетона/Tween® 80 и затем разбавили в воде до необходимой концентрации.

Молодые растения бобов обработали распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором ацетона/диметилсульфоксида/Tween® 80.

Через 24 часа, растения заразили путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Colletotrichum lindemuthianum*. Зараженные растения бобов инкубировали в течение 24 часов при температуре 20°C и при 100% относительной влажности и затем в течение 6 дней при температуре 20°C и при 90% относительной влажности.

Испытание оценивали через 7 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что никакого заболевания не наблюдалось.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 70% до 79% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-06.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 80% до 89% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-03.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-04; I-S-05.

Пример J: *in vivo* профилактическое испытание на *Alternaria brassicae*
(пятнистость листьев на редьке или капусте)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1 мкл Tween[®] 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты сделали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/ацетона/Tween[®] 80 и затем разбавили в воде до необходимой концентрации.

Молодые растения редьки или капусты обработали распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором ацетона/диметилсульфоксида/Tween[®] 80.

Через 24 часа, растения заразили путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Alternaria brassicae*. Зараженные растения редиса или капусты инкубировали в течение 6 дней при температуре 20°C и при 100% относительной влажности.

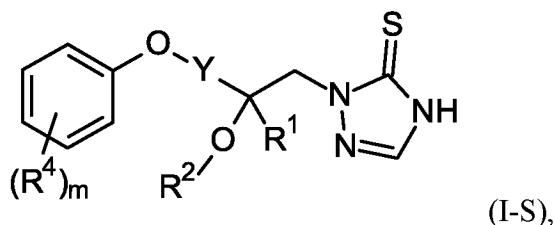
Испытание оценивали через 6 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что никакого заболевания не наблюдалось.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 80% до 89% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-04.

В данном испытании следующие соединения в соответствии с изобретением показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 500 ч./млн. активного ингредиента: I-S-03; I-S-05.

Формула изобретения

1. Производное триазола формулы (I-S)



в которой

R^1 представляет собой водород, C_1 - C_6 -алкил, C_2 - C_6 -алкенил, C_2 - C_6 -алкинил, C_3 - C_8 -циклоалкил, C_3 - C_8 -циклоалкил- C_1 - C_4 -алкил, фенил, фенил- C_1 - C_4 -алкил, фенил- C_2 - C_4 -алкенил или фенил- C_2 - C_4 -алкинил;

R^2 представляет собой водород, C_1 - C_6 -алкил, C_2 - C_6 -алкенил, C_2 - C_6 -алкинил, C_3 - C_8 -циклоалкил, C_3 - C_8 -циклоалкил- C_1 - C_4 -алкил, фенил, фенил- C_1 - C_4 -алкил, фенил- C_2 - C_4 -алкенил или фенил- C_2 - C_4 -алкинил;

причем алифатические фрагменты, за исключением циклоалкильных фрагментов, R^1 и/или R^2 могут нести 1, 2, 3 или до максимально возможного количества одинаковых или различных групп R^a , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, фенила, C_1 - C_4 -алкокси и C_1 - C_4 -галогеналкокси, причем фенил может быть замещен 1, 2, 3, 4 или 5 заместителями, которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила, C_1 - C_4 -галогеналкокси,

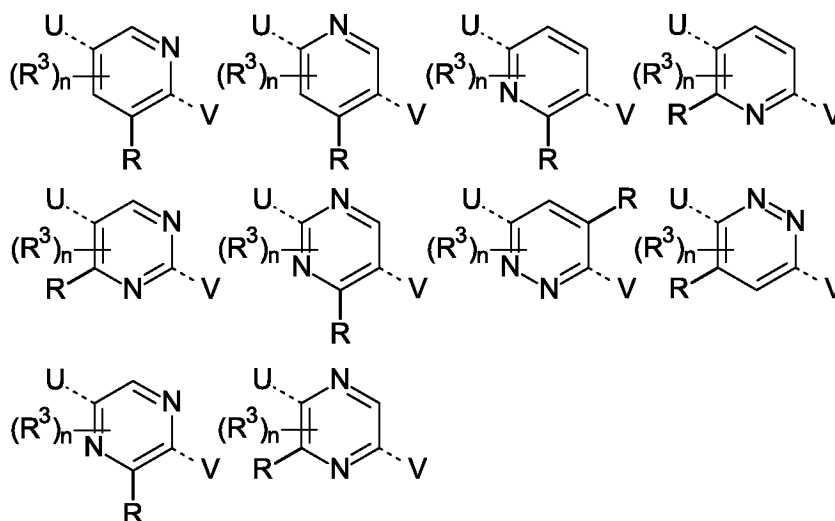
и причем циклоалкильные и/или фенильные фрагменты R^1 и/или R^2 могут нести 1, 2, 3, 4, 5 или до максимального количества одинаковых или различных групп R^b , которые независимо друг от друга выбраны из галогена, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкила, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкила и C_1 - C_4 -галогеналкокси;

каждый R^4 представляет собой независимо друг от друга галоген, CN, нитро, C_1 - C_4 -алкил, C_1 - C_4 -галогеналкил, C_3 - C_6 -циклоалкил, C_3 - C_6 -галогенциклоалкил, C_1 - C_4 -алкил- C_3 - C_6 -циклоалкил, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкокси, гидрокси-замещенный C_1 - C_4 -алкил, C_2 - C_6 -

алкенил, C₂-C₆-галогеналкенил, C₂-C₆-алкинил, C₂-C₆-галогеналкинил, C₁-C₄-алкилсульфанил, C₁-C₄-галогеналкилсульфанил, формил, C₁-C₄-алкилкарбонил, пентафтор-λ⁶-сульфанил или $-C(R^{4a})=N-OR^{4b}$, причем R^{4a} и R^{4b} представляют собой независимо друг от друга водород, C₁-C₆-алкил или фенил;

m представляет собой целое число и означает 0, 1, 2, 3, 4 или 5;

Y представляет собой 6-членный ароматический гетероцикл, содержащий 1 или 2 атома азота в качестве гетероатома(ов), выбранный из



причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную “U”, и Y связан с CR¹(OR²) фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную “V”, и

причем

R представляет собой водород, C₁-C₂-галогеналкил, C₁-C₂-галогеналкокси, C₁-C₂-алкилкарбонил или галоген;

каждый R³ представляет собой независимо друг от друга галоген, CN, нитро, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-галогеналкил, C₁-C₄-алкокси или C₁-C₄-галогеналкокси;

n представляет собой целое число и означает 0 или 1;

а также его соли или N-оксиды.

2. Производное триазола формулы (I-S) по п. 1, причем

R^1 представляет собой водород, метил, этил, пропил, изопропил, бутил, циклопропил, CF_3 , бензил, аллил, $CH_2C\equiv C-CH_3$ или $CH_2C\equiv CH$,

и/или

R^2 представляет собой водород,

а также его соли или N-оксиды.

3. Производное триазола формулы (I-S) в соответствии с, по меньшей мере, одним из пп. 1 и 2, причем

каждый R^4 представляет собой независимо друг от друга Br, Cl, F, CN, нитро, метил, этил, н-пропил, изопропил, CHF_2 , CF_3 , метокси, OCF_3 , SCH_3 , SCF_3 , пентафтор- λ^6 -сульфанил или $-C(R^{4a})=N-OR^{4b}$,

причем R^{4a} представляет собой водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил или трет-бутил, предпочтительно водород или метил, R^{4b} представляет собой водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил или трет-бутил, предпочтительно водород или метил,

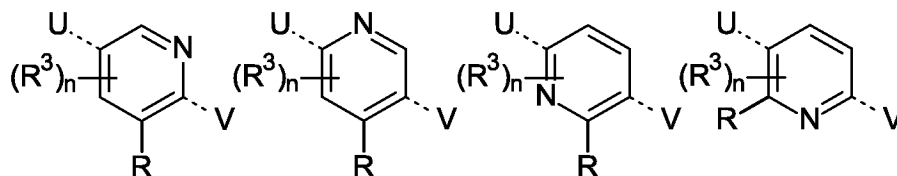
и/или

m означает 1,

а также его соли или N-оксиды.

4. Производное триазола формулы (I-S) в соответствии с, по меньшей мере, одним из пп. 1 - 3, причем

Y представляет собой 6-членный ароматический гетероцикл, содержащий 1 или 2 атома азота в качестве гетероатома(ов), выбранный из



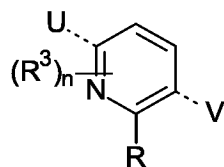
причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную “U”, и Y связан с $CR^1(OR^2)$ фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную “V”, и

причем R, R^3 и n имеют значения, как определено в п. 1,

а также его соли или N-оксиды.

5. Производное триазола формулы (I-S) в соответствии с, по меньшей мере, одним из пп. 1 - 4, причем

Y представляет собой 6-членный ароматический гетероцикл, содержащий 1 или 2 атома азота в качестве гетероатома(ов), выбранный из



причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную “U”, и Y связан с $CR^1(OR^2)$ фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную “V”, и

причем R, R^3 и n имеют значения, как определено в п. 1,

а также его соли или N-оксиды.

6. Производное триазола формулы (I-S) в соответствии с, по меньшей мере, одним из пп. 1 - 5, причем

R представляет собой CF_3 или Cl,

и/или

n означает 0,

а также его соли или N-оксиды.

7. Производное триазола формулы (I-S) по п. 1, причем

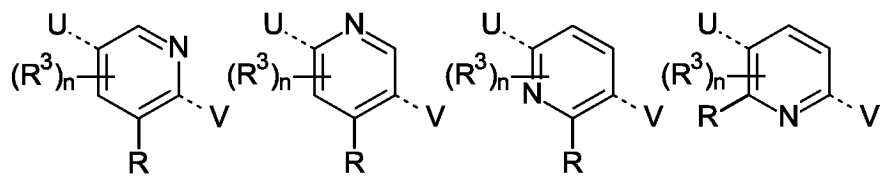
R^1 представляет собой водород или C_1 - C_4 -алкил;

R^2 представляет собой водород;

R^4 представляет собой CF_3 , CHF_2 , OCF_3 , Br, Cl или пентафтор- λ^6 -сульфанил;

m означает 1;

Y представляет собой



причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную “U”, и Y связан с $CR^1(OR^2)$ фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную “V”, и

R представляет собой C_1 -галогеналкил, F или Cl;

n означает 0;

а также его соли или N-оксиды.

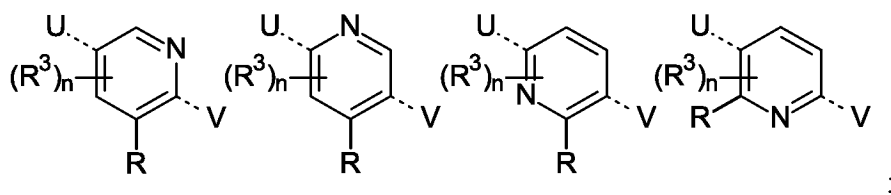
8. Производное триазола формулы (I-S) по п. 1, причем

R^1 представляет собой водород или C_1 - C_4 -алкил;

R^2 представляет собой водород;

m означает 0;

Y представляет собой



причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную “U”, и Y связан с $CR^1(OR^2)$ фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную “V”, и

R представляет собой C_1 -галогеналкил, F или Cl;

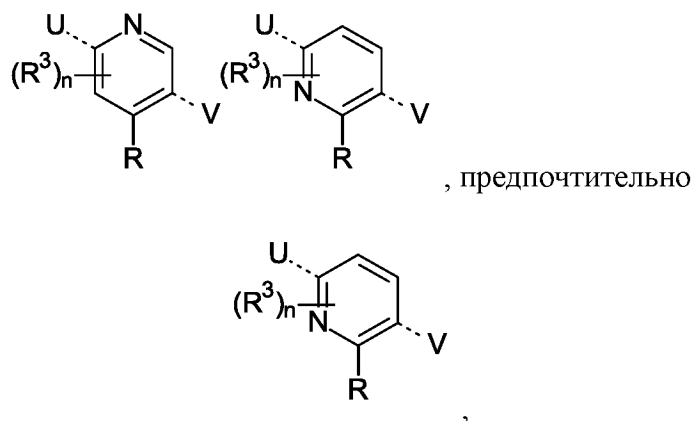
n означает 0;

а также его соли или N-оксиды.

9. Производное триазола формулы (I-S) по п. 7 или 8, причем

R^1 представляет собой водород или метил;

Y представляет собой



причем Y связан с O формулы (I-S) через связь, обозначенную “U”, и Y связан с $CR^1(OR^2)$ фрагментом формулы (I-S) через связь, обозначенную “V”, и

R представляет собой CF_3 или Cl;

n означает 0;

а также его соли или N-оксиды.

10. Композиция для борьбы с вредными микроорганизмами, предпочтительно для борьбы с фитопатогенными вредными грибами, содержащая, по меньшей мере, одно соединение формулы (I-S) по п. 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 или 9 и, по меньшей мере, один наполнитель и/или поверхностно-активное вещество.

11. Композиция по п. 10, содержащая, по меньшей мере, один дополнительный активный ингредиент, выбранный из группы инсектицидов, аттрактантов, стерилизаторов, бактерицидов, акарицидов нематоцидов, фунгицидов, регуляторов роста, гербицидов, удобрений, антидотов и химических сигнальных веществ.

12. Способ борьбы с вредными микроорганизмами при защите растений и при защите материалов, **отличающийся тем**, что, по меньшей мере, одно соединение формулы (I-S) по п. 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 или 9 и/или композицию по п. 10 или 11 наносят на вредные микроорганизмы и/или место их произрастания.

13. Способ по п. 12, причем вредный микроорганизм представляет собой фитопатогенный вредный гриб.

14. Применение, по меньшей мере, одного соединения формулы (I-S) по п. 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 или 9 и/или композиции по п. 10 или 11 для борьбы с вредными микроорганизмами, предпочтительно с фитопатогенными вредными грибами, при защите растений и при защите материалов.

15. Применение, по меньшей мере, одного соединения формулы (I-S) по п. 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 или 9 и/или композиции по п. 10 или 11 для обработки растения, предпочтительно трансгенного растения, или для обработки семян, предпочтительно семян трансгенного растения.